

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局(43) 国際公開日
2005 年 8 月 11 日 (11.08.2005)

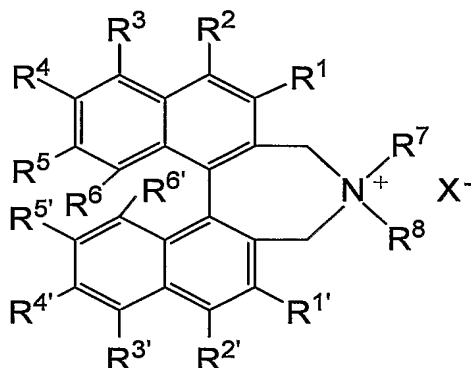
PCT

(10) 国際公開番号
WO 2005/073196 A1

- (51) 国際特許分類⁷: C07D 223/14, 498/10, 487/10, 471/10, 405/14, 409/14, C07C 249/02, 251/24, 229/34, 227/10
- (21) 国際出願番号: PCT/JP2005/001623
- (22) 国際出願日: 2005 年 1 月 27 日 (27.01.2005)
- (25) 国際出願の言語: 日本語
- (26) 国際公開の言語: 日本語
- (30) 優先権データ:
特願2004-023317 2004 年 1 月 30 日 (30.01.2004) JP
特願2004-056659 2004 年 3 月 1 日 (01.03.2004) JP
- (71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 長瀬産業株式会社 (NAGASE & CO., LTD.) [JP/JP]; 〒5508668 大阪府大阪市西区新町 1 丁目 1 番 17 号 Osaka (JP).
- (72) 発明者; および
- (75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 丸岡 啓二 (MARUOKA, Keiji) [JP/JP]; 〒6068502 京都府京都市左京区北白川追分町 国立大学法人京都大学大学院理学研究科 化学専攻有機合成化学研究室内 Kyoto (JP).
- (74) 代理人: 南條 博道 (NANJO, Hiromichi); 〒5300047 大阪府大阪市北区西天満 3 丁目 2 番 9 号 翁ビル 5 階 Osaka (JP).
- (81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.
- (84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).
- 添付公開書類:
— 国際調査報告書
- 2 文字コード及び他の略語については、定期発行される各 PCT ガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。

(54) Title: OPTICALLY ACTIVE QUATERNARY AMMONIUM SALT HAVING AXIAL ASYMMETRY AND PROCESS FOR PRODUCING α -AMINO ACID AND DERIVATIVE THEREOF WITH THE SAME

(54) 発明の名称: 軸不斉を有する光学活性な 4 級アンモニウム塩およびそれを用いた α -アミノ酸およびその誘導体の製造方法



(I)

(57) Abstract: A compound of the following formula (I). This compound (I) can be produced by reacting a 1,1'-binaphthyl 2,2'-dimethylenebromide derivative which can be produced through a relatively small number of steps with an easily available secondary amine. The compound (I) is useful as a chiral phase-transfer catalyst.

(57) 要約: 本発明によれば、以下の式 (I) の化合物: が提供される。この化合物 (I) は、比較的少ない工程で製造可能な 2, 2'-ジメチレンブロミド-1, 1'-ビナフチル誘導体と、入手が容易な 2 級アミンとを反応させることによって製造できる。この化合物 (I) は、キラル相間移動触媒として有用である。

明 細 書

軸不斉を有する光学活性な4級アンモニウム塩および
それを用いた α -アミノ酸およびその誘導体の製造方法

5

技術分野

本発明は、軸不斉を有する光学活性な4級アンモニウム塩およびその製造方法に関する。本発明はさらに、この軸不斉を有する光学活性な4級アンモニウム塩を相間移動触媒として用いた光学活性な α -アミノ酸およびその誘導体の製造方法に関する。

10

背景技術

式 $\text{H}_2\text{NCH}(\text{R})\text{COOH}$ で表される α -アルキル- α -アミノ酸は、天然に存在する非常に重要なアミノ酸である。 α -アルキル- α -アミノ酸の大部分は、 α 位炭素においてL配置を有するL体として、動物、植物、微生物などに存在し、このL体はポリペプチド鎖を構成する。一方、D体は、植物、菌類、微生物中に非タンパク性化合物として存在している。さらに、式 $\text{H}_2\text{NC}(\text{R})(\text{R}')\text{COOH}$ で表される α, α -ジアルキル- α -アミノ酸は、立体化学的に安定であること、ペプチドに組込まれるとプロテアーゼによる酵素加水分解を受けにくいことなど、その固有の機能によって近年注目されている化合物である。上記についてはBellier, B. ら、J. Med. Chem., 1997年, 40巻, p. 3947 ; およびMossel, E. ら、Tetrahedron Asymmetry, 1997年, 8巻, p. 1305を参照のこと。例えば、増強された活性を有するペプチド、有効な酵素インヒビター、および種々の生物学的活性を有する化合物の合成用のキラル構築物ブロックなどとしての利用が考えられる。このような α, α -ジアルキル- α -アミノ酸は、触媒不斉反応による調製が検討

15

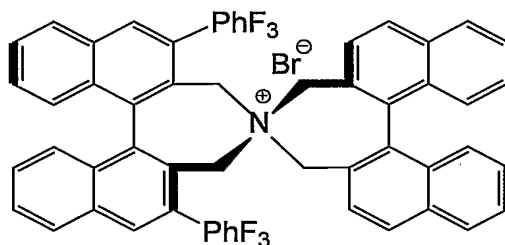
20

25

されてきたが、現在のところ、その有効な調製方法は見出されていない。

例えば、グリシン誘導体の立体選択的アルキル化を可能にするキラル相間移動触媒は、応用のしやすさからプロセス化学の分野で重要性が高まっている。これまでに、主としてシンコナアルカロイド誘導体を使用して、相間移動触媒の設計についての多くの研究が行われ、いくつかの有用な方法が報告されている（例えば、Shioiri, T. ら、*Stimulating Concepts in Chemistry*, Vogtle, F. ら編, WILEY-VCH: Weinheim, 2000年, p. 123 ; および O'Donnell, M. J., *Aldrichimica Acta*, 2001年, 34巻, p. 3 参照）。しかし、このような相間移動触媒を用いる場合、ハロゲン系溶媒を使用すること、反応に長時間を要すること、低温条件が必要であることなどの種々の問題があった。特に、上記の α , α -ジアルキル- α -アミノ酸の合成では、このようなシンコナアルカロイド由来のキラル相間移動触媒はあまり有用ではない。

本発明者らは、軸不斉を有する光学活性な 4 級アンモニウム塩を調製し、上記 α -アミノ酸を立体選択的に合成する相間移動触媒として利用できることを明らかにした（特開 2001-48866 号公報；特開 2003-81976 号公報；および Ooi, T. ら, *J. Am. Chem. Soc.*, 2000年, 122巻, p. 5228 参照）。例えば、以下の式：



（ここで、 PhF_3 は 3, 4, 5-トリフルオロフェニル基を表す）

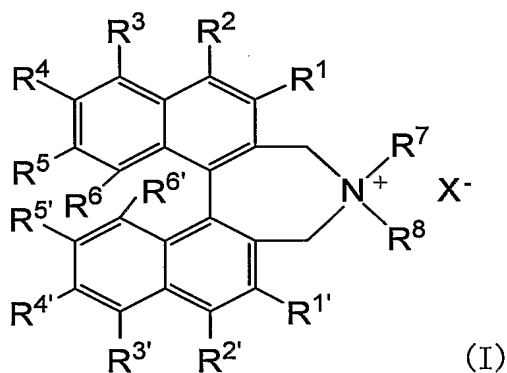
で表されるスピロ型の化合物は、グリシン誘導体の不斉二重アルキル化および α -アルキル- α -アミノ酸誘導体（例えば、アラニン誘導体）の不斉モ

ノアルキル化を行うために非常に有効である。しかし、このようなスピロ型触媒の調製には、多くの工程が必要であり、例えば、入手が容易なキラルビナフトールを出発原料とする場合、触媒の左側の構造部分の調製だけでも 11 もの工程を要する。このように、調製に非常に手間がかかり、コスト高となることが重大な欠点である。

発明の開示

本発明は、より少ない工程で製造可能な、単純化された構造を有するキラル相間移動触媒を提供することを目的とする。

本発明は、以下の式 (I) で表される、化合物：



を提供し、

ここで、 R^1 、 $R^{1'}$ 、 R^2 、 $R^{2'}$ 、 R^3 、 $R^{3'}$ 、 R^4 、 $R^{4'}$ 、 R^5 、 $R^{5'}$ 、 R^6 および $R^{6'}$ は、それぞれ独立して、

(i) 水素原子；

(ii) $-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)；

(iii) シアノ基；

(iv) ニトロ基；

(v) カルバモイル基；

(vi) N- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基；

(vii) N, N-ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基；

(viii) $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) ；

(ix) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_1 \sim C_6$ のアルキル基；

(x) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$ のアルケニル基；

(xi) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$ のアルキニル基；

(xii) アラルキル基であって、ここで、該アラルキル基を構成するアリール部分が、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、N, N-ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) で置換されていてもよい、アリアル基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル

基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アラルキル基;

5 (xiii)ヘテロアリール部分を有するヘテロアラルキル基であつて、ここで、該ヘテロアリール部分が、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$

10 (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、 N,N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

15 シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

20 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

N,N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

25 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアラルキル基;

(xiv) アリール基であって、ここで、該アリール基が、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$

5 (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ カルバモイル基、 N, N -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

10 シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

15 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ カルバモイル基、

N, N -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ハロゲン原子、および

20 $-S(O)_n-R$ (ここで、 n は 0、1 または 2 であり、そして R は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、あるいは 3, 4 位が一緒になって $-O-(CH_2)_m-O-$ (ここで、 m は 1 または 2 である) で置換されていてもよい、アリール基 ; ならびに

25 (xv) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$
(ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$
アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)
カルバモイル基、 N,N -ジ $(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、ま
たは $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル
基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素
原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

N,N -ジ $(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル
基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘ
テロアリール基；

からなる群より選択される基であり、

R^7 および R^8 はそれぞれ独立して、

(i)水素原子；

(ii)分岐または環を形成していてもよい、 $C_1 \sim C_{12}$ のアルキル基；

(iii)分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_{12}$ のアルケニル基；

(iv)分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_{12}$ のアルキニル基；

(v)アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$

5 (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、 N,N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

10 $-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

15 N,N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基；

20

(vi)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$

25 (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)

ル) カルバモイル基、N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、または-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

5 -NR²⁰R²¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁~C₄アルキル基である) 、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

10 N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である) 、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘ

15 テロアリール基 ;

(vii) - (CH₂)_n OCONR¹⁰R¹¹ (ここで、R¹⁰およびR¹¹はそれぞれ独立して、

(1) 水素原子、

(2) 分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

20 (3) 分岐または環を形成していてもよい、C₂~C₆のアルケニル基 ;

(4) 分岐または環を形成していてもよい、C₂~C₆のアルキニル基 ;

(5) アラルキル基であって、該アラルキル基を構成するアリール部分

が

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

25 分岐していてもよいC₁~C₅アルコキシ基、

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、シアノ基、-NR²⁰R²

¹ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、 N, N -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

N, N -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アラールキル基；

(6)ヘテロアリール部分を有するヘテロアラールキル基であって、該ヘテロアリール部分が、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$

(ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、 N, N -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

ル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、
水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

5 ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

$N, N\text{-ジ}(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

10 $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アル
キル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘ
テロアラルキル基;

(7)アリール基であって、該アリール基が

15 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$
1 (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim$
 C_4 アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アル}$
20 $\text{キル})$ カルバモイル基、 $N, N\text{-ジ}(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、
または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキ
ル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

25 $-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、
水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

-NHCO R⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アル

5 キル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(8)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

10 分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁~C₅アルコキシ基、

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、シアノ基、-NR²⁰R²

¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁~C₄アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N- (C₁~C₄アル

15 キル) カルバモイル基、N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

または-NHCO R⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

-NR²⁰R²¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、

20 水素原子またはC₁~C₄アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

25 -NHCO R⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そしてnは1から12の整数である) ;

(viii) — (CH₂)_n CONR¹²R¹³ (ここで、R¹²およびR¹³はそれぞれ独立して、

(1) 水素原子、

(2) 分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

(3) アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁~C₅アルコキシ基、

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、シアノ基、—NR²⁰R²¹

(ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁~C₄アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N—(C₁~C₄アル

キル) カルバモイル基、N, N—ジ(C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

または—NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

—NR²⁰R²¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁~C₄アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N—(C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

N, N—ジ(C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

—NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アル

キル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

5 (4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$

10 1 (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、 N,N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

15 $-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

20 N,N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アル

キル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

25

からなる群より選択される基であり、そして n は1から12の整数であ

る) ;

(ix) — (CH₂)_nNR¹²COR¹³ (ここで、R¹²およびR¹³はそれぞれ独立して、

(1)水素原子、

5 (2)分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、

(3)アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁～C₅アルコキシ基、

10 分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、シアノ基、—NR²⁰R²¹
 (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁～C₄アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N—(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、N, N—ジ(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、または—NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

15 シアノ基、

—NR²⁰R²¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁～C₄アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

20 N—(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、

N, N—ジ(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、

—NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基である)、および

ハロゲン原子

25 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$

5 12 (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、 N,N -ジ $(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

10 シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

15 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

N,N -ジ $(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

20 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そして n は1から12の整数である) ;

$(x)-(CH_2)_nNR^{12}R^{13}$ (ここで、 R^{12} および R^{13} はそれぞれ独立

25 して、

(1)水素原子、

(2)分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

(3)アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

5 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$

¹ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アル

キル)カルバモイル基、 N, N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキ

10 ル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

15 カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

N, N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

20 ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

25 分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$

¹ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、 N, N -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、または $-NHCO R^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

N, N -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

$-NHCO R^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そして n は1から12の整数である) ;

(xi) $-(CH_2)_n Y-OR^{12}$ (ここで、 Y は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ の二価の飽和炭化水素基であり、 R^{12} は、

(1) 水素原子、

(2) 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

(3) アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、 N, N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、
5 または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

10 ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

N, N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

15 $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

20 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、 N, N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、
25 または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

ル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

5 ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

$N, N\text{-ジ}(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

10 $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

15 からなる群より選択される基であり、そして n は1から12の整数である) ;

(xii) $-(CH_2)_n-OR^{12}$ (ここで、 R^{12} は、

(1)水素原子、

(2)分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

(3)アリール基であって、該アリール基が

20 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

25 C_4 アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、 $N, N\text{-ジ}(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキ

ル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

5 ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ カルバモイル基、

N, N -ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

10 $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

15 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ カルバモイル基、 N, N -ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、
20 または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

25 $-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

-NHCO R⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アル

5 キル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘ
テロアリール基、

10 からなる群より選択される基であり、そしてnは1から12の整数であ
る) ;

(xiii) - (CH₂)_n - S - R¹² (ここで、R¹²は、

(1)水素原子、

(2)分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

(3)アリール基であって、該アリール基が

15 分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁~C₅アルコキシ基、

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、シアノ基、-NR²⁰R²

¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁~
C₄アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N- (C₁~C₄アル

20 キル) カルバモイル基、N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

または-NHCO R⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキ
ル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

-NR²⁰R²¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、

25 水素原子またはC₁~C₄アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アル

5 キル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

10 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、-NR²⁰R²¹

¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N- ($C_1 \sim C_4$ アル

15 キル) カルバモイル基、N, N-ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

または-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

-NR²⁰R²¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、

20 水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

25 -NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そしてnは1から12の整数である) ;

(xiv) $-(CH_2)_n-SO-R^{12}$ (ここで、 R^{12} は、

(1)水素原子、

(2)分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

(3)アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$

(ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アル

キル)カルバモイル基、 N,N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、

水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

N,N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

5

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$

¹ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アル

10

キル)カルバモイル基、 N,N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、

15

水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

N,N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

20

$-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

25

からなる群より選択される基であり、そして n は1から12の整数である) ; ならびに

(xv) $-(CH_2)_n-SO_2-R^{12}$ (ここで、 R^{12} は、

(1) 水素原子、

(2) 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

(3) アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$

(ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim$

C_4 アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アル

キル) カルバモイル基、 N, N -ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、

水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

N, N -ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$
 (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$
 C_4 アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アル
 5 キル) カルバモイル基、 N, N -ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、
 または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキ
 ル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、
 10 水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

N, N -ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

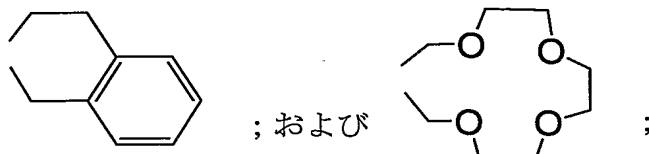
15 $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アル
 キル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、ヘ
 テロアリール基、

20 からなる群より選択される基であり、そして n は 1 から 12 の整数であ
 る) ;

からなる群より選択される基であるか、あるいは、
 R^7 および R^8 は一緒になって、 $-(CH_2)_m-$ (ここで、 m は 2 から 8 の
 整数である) ;



からなる群より選択される二価の基を表し、そして

X^- は、ハロゲン化物アニオン、 SCN^- 、 HSO_4^- 、および HF_2^- からなる群より選択されるアニオンである。

1つの実施態様によれば、上記式(I)で表される化合物の R^1 、 $R^{1'}$ 、
5 R^2 、 $R^{2'}$ 、 R^3 、 $R^{3'}$ 、 R^4 、 $R^{4'}$ 、 R^5 、 $R^{5'}$ 、 R^6 および $R^{6'}$ は、それぞれ独立して、

(i)水素原子；

(xiv)アリール基であって、ここで、該アリール基が、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

10 分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$

(ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、 N,N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、
15 または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

20 ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

N,N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル

25 基である)、

ハロゲン原子および

—S(O)_n—R（ここで、nは0、1または2であり、そしてRは分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基である）；

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよいか、あるいは3、4位が一緒になって—O—(CH₂)_m—O—（ここで、mは1
5 または2である）

で置換されていてもよい、アリール基；ならびに

(xv)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁～C₅アルコキシ基、

10 分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、シアノ基、—NR²⁰R²¹
（ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁～C₄アルキル基である）、ニトロ基、カルバモイル基、N—(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、N，N—ジ(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、または—NHCOR⁹（ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アルキル
15 基である）で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

—NR²⁰R²¹（ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁～C₄アルキル基である）、

ニトロ基、

20 カルバモイル基、

N—(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、

N，N—ジ(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、

—NHCOR⁹（ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基である）、および

25 ハロゲン原子

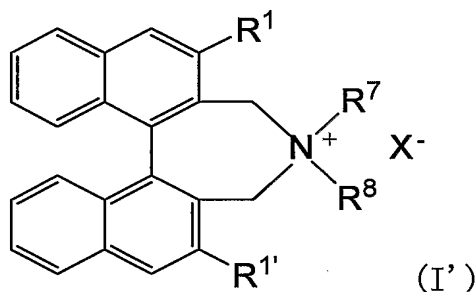
からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、へ

テロアリール基；

からなる群より選択される基である。

さらなる実施態様では、上記式 (I) で表される化合物の R^1 、 $R^{1'}$ 、 R^2 、 $R^{2'}$ 、 R^3 、 $R^{3'}$ 、 R^4 、 $R^{4'}$ 、 R^5 、 $R^{5'}$ 、 R^6 および $R^{6'}$ は、それぞれ独立して、水素原子、3, 4, 5-トリフルオロフェニル基、3, 4, 5-トリクロロフェニル基、3, 4-ジフルオロフェニル基、3-ニトロフェニル基、3-シアノフェニル基、ベンゾチオフェニル-2-イル基、3, 5-ジフルオロフェニル基、3-トリフルオロメチルフェニル基、2, 4-ジフルオロフェニル基、3-メチルスルホニルフェニル基、および2, 3-ビス(トリフルオロメチル)フェニル基からなる群より選択される基である。

さらなる実施態様では、上記式 (I) で表される化合物は、以下の式 (I') :



(ここで、 R^1 および $R^{1'}$ は、それぞれ独立して、水素原子、3, 4, 5-トリフルオロフェニル基、3, 4, 5-トリクロロフェニル基、3, 4-ジフルオロフェニル基、3-ニトロフェニル基、3-シアノフェニル基、ベンゾチオフェニル-2-イル基、3, 5-ジフルオロフェニル基、3-トリフルオロメチルフェニル基、2, 4-ジフルオロフェニル基、3-メチルスルホニルフェニル基、および2, 3-ビス(トリフルオロメチル)フェニル基からなる群より選択される基であり、そして R^7 、 R^8 および X^- は、それぞれ

れ独立して、上記と同様に定義される基である) で表される化合物である。

1つの実施態様では、上記式(I) で表される化合物の R^7 および R^8 はそれぞれ独立して、

(ii)分岐または環を形成していてもよい、 $C_1 \sim C_{12}$ のアルキル基; なら
5 びに

(xii) $-(CH_2)_n-OR^{12}$ (ここで、 R^{12} は、

(1)水素原子、

(2)分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

(3)アリール基であって、該アリール基が

10 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$

(ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アル

15 キル) カルバモイル基、 N 、 N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、
または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、

20 水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

N 、 N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

25 $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

5

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$

¹ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アル

10

キル)カルバモイル基、 N, N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、または $-NHCO R^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、

15

水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

N, N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

20

$-NHCO R^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

25

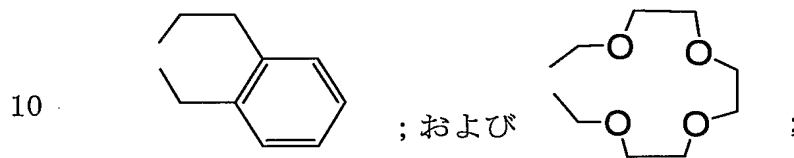
からなる群より選択される基であり、そして n は1から12の整数である) ;

からなる群より選択される基である。

別の実施態様では、上記式 (I) で表される化合物の R^7 および R^8 はそれぞれ独立して、メチル基、エチル基、 n -ブチル基、イソブチル基、 n -デシル基、およびシクロヘキシル基からなる群より選択される基である。

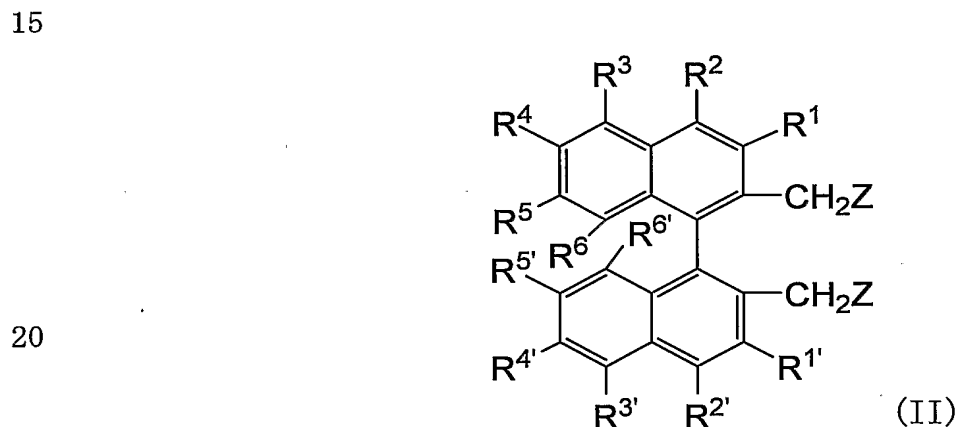
5 さらなる実施態様では、上記式 (I) で表される化合物の R^7 および R^8 は同一である。

他の実施態様では、上記式 (I) で表される化合物の R^7 および R^8 は一緒になって、 $-(CH_2)_m-$ (ここで、 m は 2 から 8 の整数である) ；



からなる群より選択される二価の基を表す。

本発明はまた、上記式 (I) で表される化合物を製造するための方法を提供し、この方法は、以下の式 (II) ；



で表される化合物を、有機溶媒中、酸捕捉剤の存在下にて、
以下の式 (III) ；



で表される 2 級アミンと反応させる工程、を包含し、
 ここで、式 (I I) において、

R^1 、 $R^{1'}$ 、 R^2 、 $R^{2'}$ 、 R^3 、 $R^{3'}$ 、 R^4 、 $R^{4'}$ 、 R^5 、 $R^{5'}$ 、 R^6 および
 $R^{6'}$ は、それぞれ独立して、

- 5 (i) 水素原子；
- (ii) $-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)；
- (iii) シアノ基；
- (iv) ニトロ基；
- 10 (v) カルバモイル基；
- (vi) $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ カルバモイル基；
- (vii) $N, N\text{-ジ}(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ カルバモイル基；
- (viii) $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)；
- 15 (ix) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_1 \sim C_6$ のアルキル基；
- (x) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$ のアルケニル基；
- (xi) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$ のアルキニル基；
- (xii) アラルキル基であって、ここで、該アラルキル基を構成するアリアル部分が、
- 20 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、
- 分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、
- 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$
- (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ カルバモイル基、 $N, N\text{-ジ}(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ カルバモイル基、また
- 25 又は $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル

基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

5 ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

N, N -ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

10 $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アラールキル基;

15 (xiii)ヘテロアリール部分を有するヘテロアラールキル基であって、ここで、該ヘテロアリール部分が、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

20 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、 N, N -ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

25 $-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

5 -NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアラルキル基；

10 (xiv) アリール基であって、ここで、該アリール基が、

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁~C₅アルコキシ基、

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、シアノ基、-NR²⁰R²¹

(ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁~C₄アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、または-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

20 -NR²⁰R²¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁~C₄アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

25 N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル

基である)、

ハロゲン原子、および

$-S(O)_n-R$ (ここで、 n は0、1または2であり、そして R は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)

- 5 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよいか、あるいは3、4位が一緒になって $-O-(CH_2)_m-O-$ (ここで m は1または2である) で置換されていてもよい、アリール基; ならびに

(xv) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

- 10 分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$

(ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、 N 、 N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

15

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

20

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

N 、 N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル

25

基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基；

からなる群より選択される基であり、そして
Zはハロゲン原子であり、

5 そして式 (I I I) において、
R⁷およびR⁸はそれぞれ独立して、

(i) 水素原子；

(ii) 分岐または環を形成していてもよい、C₁～C₁₂のアルキル基；

(iii) 分岐または環を形成していてもよい、C₂～C₁₂のアルケニル基；

10 (iv) 分岐または環を形成していてもよい、C₂～C₁₂のアルキニル基；

(v) アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁～C₅アルコキシ基、

分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、シアノ基、—NR²⁰R²¹

15 (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁～C₄アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N—(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、N, N—ジ(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、または—NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

20 シアノ基、

—NR²⁰R²¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁～C₄アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

25 N—(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、

N, N—ジ(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、

—NHCOR⁹（ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基である）、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基；

(vi)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁～C₅アルコキシ基、

分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、シアノ基、—NR²⁰R²¹

（ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁～C₄アルキル基である）、ニトロ基、カルバモイル基、N—（C₁～C₄アルキル）カルバモイル基、N，N—ジ（C₁～C₄アルキル）カルバモイル基、または—NHCOR⁹（ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基である）で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

—NR²⁰R²¹（ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁～C₄アルキル基である）、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N—（C₁～C₄アルキル）カルバモイル基、

N，N—ジ（C₁～C₄アルキル）カルバモイル基、

—NHCOR⁹（ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基である）、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基；

(vii) — (CH₂)_n OCONR¹⁰R¹¹ (ここで、R¹⁰およびR¹¹はそれぞれ独立して、

(1) 水素原子、

(2) 分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、

5 (3) 分岐または環を形成していてもよい、C₂～C₆のアルケニル基；

(4) 分岐または環を形成していてもよい、C₂～C₆のアルキニル基；

(5) アラルキル基であって、該アラルキル基を構成するアリール部分が

分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、

10 分岐していてもよいC₁～C₅アルコキシ基、

分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、シアノ基、—NR²⁰R²¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁～C₄アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N—(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、N, N—ジ(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、
15 または—NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

—NR²⁰R²¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁～C₄アルキル基である)、

20 ニトロ基、

カルバモイル基、

N—(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、

N, N—ジ(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、

—NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アラルキル基；

(6)ヘテロアリール部分を有するヘテロアラルキル基であって、該ヘテロアリール部分が、

5 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、 N,N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、
10 または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、
15 水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

N,N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

20 $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアラルキル基；

25 (7)アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$
 (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アル
 5 キル)カルバモイル基、 N, N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、
 または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、
 10 水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

N, N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

15 $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

20 (8)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$
 (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アル
 25 キル)カルバモイル基、 N, N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

または $-\text{NHCOR}^9$ （ここで、 R^9 は分岐していてもよい $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基である）で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-\text{NR}^{20}\text{R}^{21}$ （ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、

5 水素原子または $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基である）、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$\text{N}-$ （ $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル）カルバモイル基、

N 、 $\text{N}-\text{ジ}$ （ $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル）カルバモイル基、

10 $-\text{NHCOR}^9$ （ここで、 R^9 は分岐していてもよい $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基である）、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

15 からなる群より選択される基であり、そして n は1から12の整数である）；

(viii) $-(\text{CH}_2)_n\text{CONR}^{12}\text{R}^{13}$ （ここで、 R^{12} および R^{13} はそれぞれ独立して、

(1)水素原子、

20 (2)分岐していてもよい $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基、

(3)アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $\text{C}_1 \sim \text{C}_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基、シアノ基、 $-\text{NR}^{20}\text{R}^{21}$

25 1 （ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基である）、ニトロ基、カルバモイル基、 $\text{N}-$ （ $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アル

キル) カルバモイル基、N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、
 または-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル
 基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

5 -NR²⁰R²¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、
 水素原子またはC₁~C₄アルキル基である) 、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

10 N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アル
 キル基である) 、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ア

15 リール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁~C₅アルコキシ基、

20 分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、シアノ基、-NR²⁰R²¹
¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁~
 C₄アルキル基である) 、ニトロ基、カルバモイル基、N- (C₁~C₄アル
 キル) カルバモイル基、N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、
 または-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキ
 ル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

25 シアノ基、

-NR²⁰R²¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、

水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

5 N, N-ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

-NHCO R^9 (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘ

10 テロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そしてnは1から12の整数である) ;

(ix) - (CH_2)_nNR¹²CO R^{13} (ここで、 R^{12} および R^{13} はそれぞれ独立して、

15 (1)水素原子、

(2)分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

(3)アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

20 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、-NR²⁰R²¹

(ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、N, N-ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、または-NHCO R^9 (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

25 シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

5 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

N, N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

$-NHCO R^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

10 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

15 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、 N, N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、または $-NHCO R^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

20

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

25 カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

N, N-ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、
 $-NHCO R^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アル
 キル基である)、および
 ハロゲン原子

5 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘ
 テロアリール基、
 からなる群より選択される基であり、そして n は1から12の整数であ
 る) ;

10 (x) - $(CH_2)_n NR^{12} R^{13}$ (ここで、 R^{12} および R^{13} はそれぞれ独立
 して、

(1) 水素原子、

(2) 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

(3) アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

15 分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20} R^{21}$
 (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim$
 C_4 アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N- ($C_1 \sim C_4$ アル
 キル) カルバモイル基、N, N-ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、
 20 または $-NHCO R^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキ
 ル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20} R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、
 水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

25 ニトロ基、

カルバモイル基、

N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である)、および

5 ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

10 分岐していてもよいC₁~C₅アルコキシ基、

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、シアノ基、-NR²⁰R²¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁~C₄アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、
15 または-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

-NR²⁰R²¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁~C₄アルキル基である)、

20 ニトロ基、

カルバモイル基、

N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である)、および

25 ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そしてnは1から12の整数である) ;

5 (xi) — (CH₂)_nY—OR¹² (ここで、Yは分岐していてもよいC₁~C₄の二価の飽和炭化水素基であり、R¹²は、

(1)水素原子、

(2)分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

(3)アリール基であって、該アリール基が

10 分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁~C₅アルコキシ基、

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、シアノ基、—NR²⁰R²¹

(ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁~C₄アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N—(C₁~C₄アル

15 キル)カルバモイル基、N,N—ジ(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基、または—NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

—NR²⁰R²¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、

20 水素原子またはC₁~C₄アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N—(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基、

N,N—ジ(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基、

25 —NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

5 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、 N,N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、
10 または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

15 $-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

N,N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

20 $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

25 からなる群より選択される基であり、そして n は1から12の整数である) ;

(xii) $-(CH_2)_n-OR^{12}$ (ここで、 R^{12} は、

(1) 水素原子、

(2) 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

(3) アリール基であって、該アリール基が

5 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$

¹ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アル

10 キル) カルバモイル基、 N, N -ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、

15 水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

N, N -ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

20 $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

25 (4) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、
5 N,N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、
10 水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

N,N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

15 $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

20 からなる群より選択される基であり、そして n は1から12の整数である) ;

(xiii) $-(CH_2)_n-S-R^{12}$ (ここで、 R^{12} は、

(1)水素原子、

(2)分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

25 (3)アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、
5 N,N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、
10 水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

N,N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

15 $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

20 (4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、
25 N,N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

または $-\text{NHCOR}^9$ （ここで、 R^9 は分岐していてもよい $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基である）で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-\text{NR}^{20}\text{R}^{21}$ （ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、
5 水素原子または $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基である）、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$\text{N}-$ （ $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル）カルバモイル基、

$\text{N}, \text{N}-$ ジ（ $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル）カルバモイル基、

10 $-\text{NHCOR}^9$ （ここで、 R^9 は分岐していてもよい $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基である）、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

15 からなる群より選択される基であり、そして n は1から12の整数である）；

(xiv) $-(\text{CH}_2)_n-\text{SO}-\text{R}^{12}$ （ここで、 R^{12} は、

(1)水素原子、

(2)分岐していてもよい $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基、

20 (3)アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $\text{C}_1 \sim \text{C}_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基、シアノ基、 $-\text{NR}^{20}\text{R}^{21}$ （ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基である）、ニトロ基、カルバモイル基、 $\text{N}-$ （ $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル）カルバモイル基、 $\text{N}, \text{N}-$ ジ（ $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル）カルバモイル基、
25

または $\text{-NHCO}\text{R}^9$ （ここで、 R^9 は分岐していてもよい $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ アルキル基である）で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$\text{-NR}^{20}\text{R}^{21}$ （ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、
5 水素原子または $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ アルキル基である）、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$\text{N- (C}_1\sim\text{C}_4\text{アルキル) カルバモイル基、}$

$\text{N, N-ジ (C}_1\sim\text{C}_4\text{アルキル) カルバモイル基、}$

10 $\text{-NHCO}\text{R}^9$ （ここで、 R^9 は分岐していてもよい $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ アルキル基である）、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

15 (4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が
分岐していてもよい $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ アルキル基、
分岐していてもよい $\text{C}_1\sim\text{C}_5$ アルコキシ基、
分岐していてもよい $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ アルキル基、シアノ基、 $\text{-NR}^{20}\text{R}^{21}$
1 (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $\text{C}_1\sim$
20 C_4 アルキル基である）、ニトロ基、カルバモイル基、 $\text{N- (C}_1\sim\text{C}_4\text{アルキル) カルバモイル基、}$
 $\text{N, N-ジ (C}_1\sim\text{C}_4\text{アルキル) カルバモイル基、}$
または $\text{-NHCO}\text{R}^9$ （ここで、 R^9 は分岐していてもよい $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ アルキル基である）で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

25 $\text{-NR}^{20}\text{R}^{21}$ （ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、
水素原子または $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ アルキル基である）、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

5 -NHCO R⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

10 からなる群より選択される基であり、そしてnは1から12の整数である) ; ならびに

(xv) - (CH₂)_n - SO₂ - R¹² (ここで、R¹²は、

(1)水素原子、

(2)分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

15 (3)アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁~C₅アルコキシ基、

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、シアノ基、-NR²⁰R²

20 ¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁~C₄アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、または-NHCO R⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

25 -NR²⁰R²¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁~C₄アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

5 -NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

10 (4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁~C₅アルコキシ基、

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、シアノ基、-NR²⁰R²¹

15 ¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁~C₄アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、または-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

20 -NR²⁰R²¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁~C₄アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

25 N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アル

キル基である)、および

ハロゲン原子

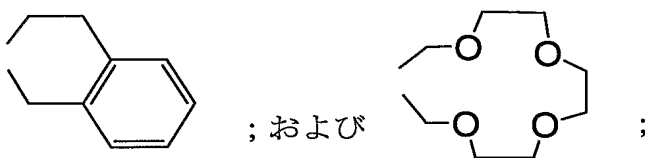
からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

5 からなる群より選択される基であり、そしてnは1から12の整数である) ;

からなる群より選択される基であるか、あるいは、

R⁷およびR⁸は一緒になって、 $-(CH_2)_m-$ (ここで、mは2から8の整数である) ;

10



からなる群より選択される二価の基を表す。

1つの実施態様では、上記式 (I I) で表される化合物のR¹、R^{1'}、R²、R^{2'}、R³、R^{3'}、R⁴、R^{4'}、R⁵、R^{5'}、R⁶およびR^{6'}は、それぞれ独立して、

(i) 水素原子 ;

(xiv) アリール基であって、ここで、該アリール基が、

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

20

分岐していてもよいC₁~C₅アルコキシ基、

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$

(ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁~C₄アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N-(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基、N,N-ジ(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基、または $-NHCO R^9$ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

25

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

5 カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

$N, N\text{-ジ}(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

$-NHCO R^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

10 ハロゲン原子および

$-S(O)_n-R$ (ここで、 n は0、1または2であり、そして R は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) ;

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよいが、あるいは3, 4位が一緒になって $-O-(CH_2)_m-O-$ (ここで、 m は1
15 または2である)

で置換されていてもよい、アリール基 ; ならびに

(xv)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

20 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$
(ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、 $N, N\text{-ジ}(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、または $-NHCO R^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル
25 基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

—NR²⁰R²¹（ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁～C₄アルキル基である）、

ニトロ基、

カルバモイル基、

5 N—（C₁～C₄アルキル）カルバモイル基、

N，N—ジ（C₁～C₄アルキル）カルバモイル基、

—NHCO R⁹（ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基である）、および

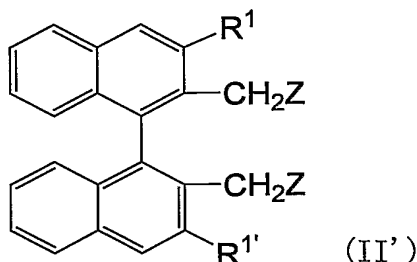
ハロゲン原子

10 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基；

からなる群より選択される基である。

さらなる実施態様では、上記式（I I）で表される化合物のR¹、R^{1'}、R²、R^{2'}、R³、R^{3'}、R⁴、R^{4'}、R⁵、R^{5'}、R⁶およびR^{6'}は、それぞれ独立して、水素原子、3，4，5—トリフルオロフェニル基、3，4，5—トリクロロフェニル基、3，4—ジフルオロフェニル基、3—ニトロフェニル基、3—シアノフェニル基、ベンゾチオフェニル—2—イル基、3，5—ジフルオロフェニル基、3—トリフルオロメチルフェニル基、2，4—ジフルオロフェニル基、3—メチルスルホニルフェニル基、および2，3—ビス（トリフルオロメチル）フェニル基からなる群より選択される基である。

さらなる実施態様では、上記式（I I）で表される化合物は、以下の式（I I'）：



(ここで、 R^1 および $R^{1'}$ は、それぞれ独立して、水素原子、3, 4, 5-トリフルオロフェニル基、3, 4, 5-トリクロロフェニル基、3, 4-ジフルオロフェニル基、3-ニトロフェニル基、3-シアノフェニル基、ベンゾチオフェニル-2-イル基、3, 5-ジフルオロフェニル基、3-トリフルオロメチルフェニル基、2, 4-ジフルオロフェニル基、3-メチルスルホニルフェニル基、および2, 3-ビス(トリフルオロメチル)フェニル基からなる群より選択される基であり、そして R^7 、 R^8 および Z は、それぞれ独立して、上記と同様に定義される基である)で表される化合物である。

別の実施態様では、上記式(I I)で表される2級アミンの R^7 および R^8 はそれぞれ独立して、

(ii)分岐または環を形成していてもよい、 $C_1 \sim C_{12}$ のアルキル基；ならびに

(xii) $-(CH_2)_n-OR^{12}$ (ここで、 R^{12} は、

(1)水素原子、

(2)分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

(3)アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$

(ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、 N, N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、

水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

5 N, N-ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

-NHCO R^9 (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ア

10 リール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、-NR²⁰R²

15 ¹ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、N, N-ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、または-NHCO R^9 (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

20 シアノ基、

-NR²⁰R²¹ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、

水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

25 N- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

—NHCOR⁹（ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基である）、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

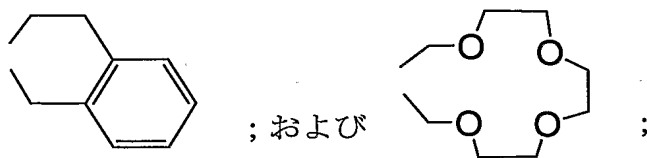
からなる群より選択される基であり、そしてnは1から12の整数である）；

からなる群より選択される基である。

さらなる実施態様では、上記式（I I）で表される2級アミンのR⁷およびR⁸はそれぞれ独立して、メチル基、エチル基、n-ブチル基、イソブチル基、n-デシル基、およびシクロヘキシル基からなる群より選択される基である。

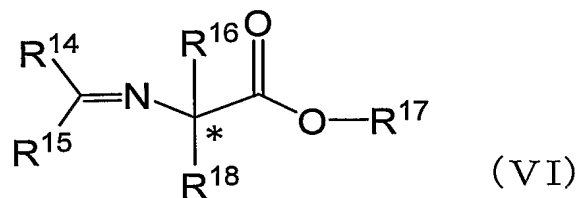
なおさらなる実施態様では、上記式（I I）で表される2級アミンのR⁷およびR⁸は同一である。

他の実施態様では、上記式（I I）で表される2級アミンのR⁷およびR⁸は一緒になって、—(CH₂)_m—（ここで、mは2から8の整数である）；



からなる群より選択される二価の基を表す。

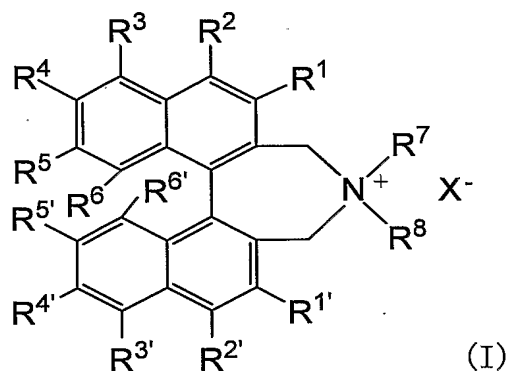
本発明はさらに、式（V I）で表される化合物：



を立体選択的に製造するための方法を提供し、この方法は、

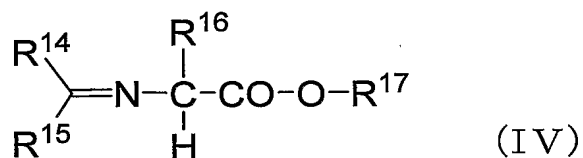
軸不斉に関して純粋な式 (I) :

5



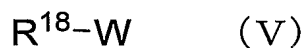
(I)

10 で表される化合物を相間移動触媒として用い、式 (I V) で表される化合物 :



(IV)

15 を、媒体中、無機塩基の存在下、式 (V) の化合物 :



でアルキル化する工程、を包含し、

ここで、式 (I) において、

R¹、R^{1'}、R²、R^{2'}、R³、R^{3'}、R⁴、R^{4'}、R⁵、R^{5'}、R⁶および

20 R^{6'} は、それぞれ独立して、

(i) 水素原子 ;

(ii) -NR²⁰R²¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁~C₄アルキル基である) ;

(iii) シアノ基 ;

25 (iv) ニトロ基 ;

(v) カルバモイル基 ;

(vi) N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基 ;

(vii) N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基 ;

(viii) -NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である) ;

5 (ix) 分岐または環を形成していてもよい、C₁~C₆のアルキル基 ;

(x) 分岐または環を形成していてもよい、C₂~C₆のアルケニル基 ;

(xi) 分岐または環を形成していてもよい、C₂~C₆のアルキニル基 ;

(xii) アラルキル基であって、ここで、該アラルキル基を構成するアリール部分が、

10 分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁~C₅アルコキシ基、

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、シアノ基、-NR²⁰R²¹

(ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁~C₄アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N- (C₁~C₄アルキル)

15 カルバモイル基、N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、または-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

-NR²⁰R²¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素

20 原子またはC₁~C₄アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

25 -NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アラルキル基；

(xiii)ヘテロアリール部分を有するヘテロアラルキル基であって、ここで、
5 該ヘテロアリール部分が、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$
(ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$
10 C_4 アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)
カルバモイル基、 N,N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、または
 $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル
基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

15 $-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素
原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

20 N,N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル
基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘ
25 テロアラルキル基；

(xiv)アリール基であって、ここで、該アリール基が、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$
 (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$
 アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)
 カルバモイル基、 N,N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、ま
 たは $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル
 基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素
 原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

N,N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル
 基である)、

ハロゲン原子、および

$-S(O)_n-R$ (ここで、 n は0、1または2であり、そして R は分
 岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよいか、
 あるいは3、4位が一緒になって $-O-(CH_2)_m-O-$ (ここで、 m は1
 または2である)で置換されていてもよい、アリール基；ならびに

(xv)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$
(ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$
アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)
カルバモイル基、 N,N -ジ $(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、ま
5 たは $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル
基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素
原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

10

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

N,N -ジ $(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル
15 基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘ
テロアリール基；

からなる群より選択される基であり、

20

R^7 および R^8 はそれぞれ独立して、一価の有機基であるか、あるいは一緒にな
って二価の有機基を表し、そして

X^- は、ハロゲン化物アニオンであり、

式(IV)および式(VI)において、

R^{14} および R^{15} は、それぞれ独立して、

25

(i)水素原子；あるいは

(ii)分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基か、分岐していてもよい C_1

～C₅アルコキシ基か、またはハロゲン原子かで置換されていてもよい、アリール基；

であり、ただしR¹⁴およびR¹⁵がともに水素原子である場合を除き、

R¹⁶は、

5 (i) 水素原子；

(ii) 分岐または環を形成していてもよい、C₁～C₁₀のアルキル基；

(iii) 分岐または環を形成していてもよい、C₂～C₆のアルケニル基；

(iv) 分岐または環を形成していてもよい、C₂～C₆のアルキニル基；

(v) アラルキル基であって、該アラルキル基を構成するアリール部分が

10 分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁～C₅アルコキシ基、

分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、シアノ基、－NR²⁰R²¹

(ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁～C₄アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N－(C₁～C₄アルキル)

15 カルバモイル基、N、N－ジ(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、または－NHCOR⁹(ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

－NR²⁰R²¹(ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素
20 原子またはC₁～C₄アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N－(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、

N、N－ジ(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、

25 －NHCOR⁹(ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アラルキル基；

(vi) ヘテロアリール部分を有するヘテロアラルキル基であって、該ヘテロアリール部分が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$

(ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、 N,N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

N,N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアラルキル基；

(vii)アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$

(ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$

5 C_4 アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)

カルバモイル基、 N, N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、ま

たは $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

10 $-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

15 N, N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ア

20 リール基;ならびに

(viii)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$

25 (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$

C_4 アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)

ル) カルバモイル基、N, N-ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、または $-NHCO R^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

- 5 $-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

- 10 N, N-ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

$-NHCO R^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、ヘ

- 15 テロアリール基；

からなる群より選択される基であり、

R^{17} は、分岐または環を形成していてもよい $C_1 \sim C_8$ アルキル基であり、

式 (V) および式 (VI) において、

R^{18} は、

- 20 (i) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル基；

(ii) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_3 \sim C_9$ のアリル基または置換アリル基；

(iii) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$ のアルケニル基；

(iv) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$ のアルキニル基；

- 25 (v) アラルキル基であって、該アラルキル基を構成するアリール部分が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$

(ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)

5 カルバモイル基、 N, N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

10 $-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

N, N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

15 $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アラールキル基；

20 (vi)ヘテロアリール部分を有するヘテロアラールキル基であって、該ヘテロアリール部分が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$

25 (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)

ル) カルバモイル基、N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、または-NHCO R⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

5 -NR²⁰R²¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁~C₄アルキル基である) 、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

10 N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

-NHCO R⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である) 、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘ

15 テロアラルキル基 ;

(vii) アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁~C₅アルコキシ基、

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、シアノ基、-NR²⁰R²¹

20 (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁~C₄アルキル基である) 、ニトロ基、カルバモイル基、N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、または-NHCO R⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

25 シアノ基、

-NR²⁰R²¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素

原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

5 N, N-ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

-NHCO R^9 (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ア

10 リール基;

(viii) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、-NR²⁰R²¹

15 (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、N, N-ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、または-NHCO R^9 (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

20 シアノ基、

-NR²⁰R²¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

25 N- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

—NHCOR⁹（ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基である）、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基；ならびに

(ix)分岐していてもよい、C₃～C₉のプロパルギル基または置換プロパルギル基；

からなる群より選択される基であり、式（V）において、

Wは、脱離能を有する官能基であり、

そして式（VI）において

*は、新たに生成する不斉中心を示す。

1つの実施態様では、上記式（I）で表される化合物のR⁷およびR⁸は、それぞれ独立して、

(i)分岐または環を形成していてもよく、および／またはハロゲン原子で置換されていてもよい、C₁～C₁₂のアルキル基；

(ii)分岐または環を形成していてもよく、および／またはハロゲン原子で置換されていてもよい、C₂～C₁₂のアルケニル基；

(iii)分岐または環を形成していてもよく、および／またはハロゲン原子で置換されていてもよい、C₂～C₁₂のアルキニル基；

(iv)アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁～C₅アルコキシ基、

分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、シアノ基、—NR²⁰R²¹

（ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁～C₄アルキル基である）、ニトロ基、カルバモイル基、N—（C₁～C₄アルキ

ル) カルバモイル基、N, N-ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、または $-NHCO R^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

5 $-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) 、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

10 N, N-ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

$-NHCO R^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) 、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ア

15 リール基 ;

(v) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$

20 (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) 、ニトロ基、カルバモイル基、N- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、N, N-ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、または $-NHCO R^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

25 シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素

原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N-($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

5 N, N-ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

-NHCO R^9 (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘ

10 テロアリール基;

(vi)-(CH_2) $_n$ OCON $R^{10}R^{11}$ (ここで、 R^{10} および R^{11} はそれぞれ独立して、

(1)水素原子、

(2)分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

15 (3)分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$ のアルケニル基;

(4)分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$ のアルキニル基;

(5)アラルキル基であって、該アラルキル基を構成するアリール部分

が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

20 分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、-N $R^{20}R^{21}$

¹ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N-($C_1 \sim C_4$ アル

キル)カルバモイル基、N, N-ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

25 または-NHCO R^9 (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

5

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

$N, N\text{-ジ}(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

$-NHCO R^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

10

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アラルキル基；

(6)ヘテロアリール部分を有するヘテロアラルキル基であって、該ヘテロアリール部分が、

15

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

20

$N, N\text{-ジ}(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、または $-NHCO R^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

25

ニトロ基、

カルバモイル基、

N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

-NHCO R⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アル

5 キル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘ
テロアラルキル基;

(7)アリール基であって、該アリール基が

10 分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁~C₅アルコキシ基、

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、シアノ基、-NR²⁰R²¹

¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁~
C₄アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N- (C₁~C₄アル

15 キル) カルバモイル基、N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

または-NHCO R⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキ
ル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

-NR²⁰R²¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、

20 水素原子またはC₁~C₄アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

25 -NHCO R⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アル
キル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(8)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

5

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$

¹ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アル

10

キル)カルバモイル基、 N, N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、

15

水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

N, N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

20

$-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

25

からなる群より選択される基であり、そして n は1から12の整数である) ;

(vii) $-(CH_2)_n CONR^{12}R^{13}$ (ここで、 R^{12} および R^{13} はそれぞれ独立して、

(1) 水素原子、

(2) 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

5 (3) アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、 N,N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

15 $-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

20 N,N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

25

(4) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、 N,N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

N,N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、からなる群より選択される基であり、そして n は1から12の整数である) ;

(viii) $-(CH_2)_nNR^{12}COR^{13}$ (ここで、 R^{12} および R^{13} はそれぞれ独立して、

(1)水素原子、

(2)分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

(3) アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$

5 1 (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、 N,N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

10 シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

15 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

N,N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

20 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

25 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$

1 (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim$

C₄アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N-(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基、N,N-ジ(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基、または-NHCOR⁹(ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

5 シアノ基、

-NR²⁰R²¹(ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁~C₄アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

10 N-(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基、

N,N-ジ(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基、

-NHCOR⁹(ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である)、および

ハロゲン原子

15 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そしてnは1から12の整数である) ;

(ix) -(CH₂)_nNR¹²R¹³(ここで、R¹²およびR¹³はそれぞれ独立して、

(1)水素原子、

(2)分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

(3)アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

25 分岐していてもよいC₁~C₅アルコキシ基、

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、シアノ基、-NR²⁰R²

¹ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、 N, N -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

N, N -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$

(ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、 N, N -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

5

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

N, N -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

$-NHCO R^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

10

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そして n は1から12の整数である) ;

15

(x) $-(CH_2)_n Y-OR^{12}$ (ここで、 Y は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ の二価の飽和炭化水素基であり、 R^{12} は、

(1)水素原子、

(2)分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

(3)アリール基であって、該アリール基が

20

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、 N, N -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、
25 または $-NHCO R^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキ

ル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

5 ニトロ基、

カルバモイル基、

N- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

10 $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

15 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、N, N-ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、
20 または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

25 $-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

-NHCO R⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アル

5 キル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

10 からなる群より選択される基であり、そしてnは1から12の整数である) ;

(xi) - (CH₂)_n - OR¹² (ここで、R¹²は、

(1)水素原子、

(2)分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

(3)アリール基であって、該アリール基が

15 分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁~C₅アルコキシ基、

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、シアノ基、-NR²⁰R²¹

1 (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁~C₄アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N- (C₁~C₄アル

20 キル) カルバモイル基、N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

または-NHCO R⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

-NR²⁰R²¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、

25 水素原子またはC₁~C₄アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

-NHCO R⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アル

5 キル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

10 分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁~C₅アルコキシ基、

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、シアノ基、-NR²⁰R²¹

(ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁~C₄アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N- (C₁~C₄アル

15 キル) カルバモイル基、N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

または-NHCO R⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

-NR²⁰R²¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、

20 水素原子またはC₁~C₄アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

25 -NHCO R⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そしてnは1から12の整数である) ;

(xii) $-(CH_2)_n-S-R^{12}$ (ここで、 R^{12} は、

(1) 水素原子、

(2) 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

(3) アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$

(ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アル

キル)カルバモイル基、N, N-ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、

水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

N, N-ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アル

キル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

5 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、 N,N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

15 $-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

N,N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

20 $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

25 からなる群より選択される基であり、そして n は1から12の整数である) ;

(xiii) — (CH₂)_n — SO — R¹² (ここで、R¹²は、

(1)水素原子、

(2)分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、

(3)アリール基であって、該アリール基が

5 分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁～C₅アルコキシ基、

分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、シアノ基、—NR²⁰R²

¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁～

C₄アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N—(C₁～C₄アル

10 キル)カルバモイル基、N, N—ジ(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、

または—NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

—NR²⁰R²¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、

15 水素原子またはC₁～C₄アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N—(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、

N, N—ジ(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、

20 —NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

25 (4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$
 1 (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アル
 5 キル)カルバモイル基、 N, N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、
 または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

10 $-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、
 水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

N, N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

15 $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アル
 キル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘ
 テロアリール基、

20 からなる群より選択される基であり、そして n は1から12の整数であ
 る) ; ならびに

(xiv) $-(CH_2)_n-SO_2-R^{12}$ (ここで、 R^{12} は、

(1)水素原子、

(2)分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

25 (3)アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$
 1 (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アル
 5 キル)カルバモイル基、 N,N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、
 または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、
 10 水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

N,N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

15 $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

20 (4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$
 1 (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アル
 25 C_4 アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アル
 キル)カルバモイル基、 N,N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

または -NHCO R^9 （ここで、 R^9 は分岐していてもよい $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基である）で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$\text{-NR}^{20}\text{R}^{21}$ （ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、
5 水素原子または $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基である）、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$\text{N- (C}_1 \sim \text{C}_4 \text{アルキル) カルバモイル基、}$

$\text{N, N-ジ (C}_1 \sim \text{C}_4 \text{アルキル) カルバモイル基、}$

10 -NHCO R^9 （ここで、 R^9 は分岐していてもよい $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基である）、および

ハロゲン原子

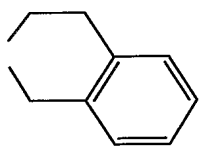
からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

15 からなる群より選択される基であり、そして n は1から12の整数である）；

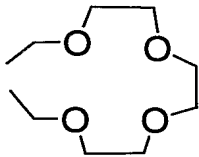
からなる群より選択される基であるか、あるいは、

一緒になって、 $\text{-(CH}_2\text{)}_m\text{-}$ （ここで、 m は2から8の整数である）；

20



；および



；

からなる群より選択される二価の基である。

1つの実施態様では、上記式（I）で表される化合物の R^1 、 $\text{R}^{1'}$ 、 R^2 、
25 $\text{R}^{2'}$ 、 R^3 、 $\text{R}^{3'}$ 、 R^4 、 $\text{R}^{4'}$ 、 R^5 、 $\text{R}^{5'}$ 、 R^6 および $\text{R}^{6'}$ は、それぞれ独立して、

(i) 水素原子；

(xiv) アリール基であつて、ここで、該アリール基が、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

5 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$

(ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)

カルバモイル基、 N, N -ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル

10 基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

15 カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

N, N -ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

20 ハロゲン原子および

$-S(O)_n-R$ (ここで、 n は 0、1 または 2 であり、そして R は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)；

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよいか、

あるいは 3、4 位が一緒になって $-O-(CH_2)_m-O-$ (ここで、 m は 1

25 または 2 である)

で置換されていてもよい、アリール基；ならびに

(xv)ヘテロアリール基であつて、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$

5 (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、 N,N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

10 シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

15 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

N,N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

20 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基；

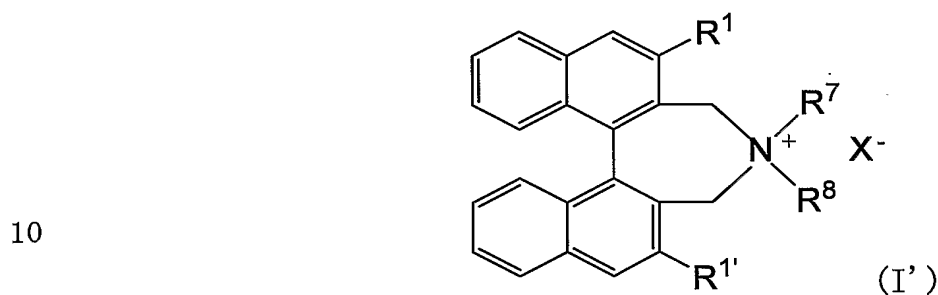
からなる群より選択される基である。

さらなる実施態様では、上記式(I)で表される化合物の R^1 、 $R^{1'}$ 、 R^2 、 $R^{2'}$ 、 R^3 、 $R^{3'}$ 、 R^4 、 $R^{4'}$ 、 R^5 、 $R^{5'}$ 、 R^6 および $R^{6'}$ は、それぞれ独立して、水素原子、3,4,5-トリフルオロフェニル基、3,4,5-トリクロロフェニル基、3,4-ジフルオロフェニル基、3-ニトロフェ

25

ニル基、3-シアノフェニル基、ベンゾチオフェニル-2-イル基、3, 5-ジフルオロフェニル基、3-トリフルオロメチルフェニル基、2, 4-ジフルオロフェニル基、3-メチルスルホニルフェニル基、および2, 3-ビス(トリフルオロメチル)フェニル基からなる群より選択される基である。

5 さらなる実施態様では、上記式(I)で表される化合物は、以下の式(I') :



(ここで、 R^1 および $R^{1'}$ は、それぞれ独立して、水素原子、3, 4, 5-トリフルオロフェニル基、3, 4, 5-トリクロロフェニル基、3, 4-ジフルオロフェニル基、3-ニトロフェニル基、3-シアノフェニル基、ベン
15 ゴチオフェニル-2-イル基、3, 5-ジフルオロフェニル基、3-トリフル
 ロメチルフェニル基、2, 4-ジフルオロフェニル基、3-メチルスル
 ホニルフェニル基、および2, 3-ビス(トリフルオロメチル)フェニル基
 からなる群より選択される基であり、そして R^7 、 R^8 および X^- は、それぞ
 れ独立して、上記と同様に定義される基である)で表される化合物である。

20 別の実施態様では、上記式(I)で表される化合物の R^7 および R^8 はそれ
 ぞれ独立して、

(ii)分岐または環を形成していてもよい、 $C_1 \sim C_{12}$ のアルキル基；なら
 びに

(xii) $-(CH_2)_n-OR^{12}$ (ここで、 R^{12} は、

25 (1)水素原子、

(2)分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

(3) アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$

5 ¹ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、 N, N -ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

10 シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

15 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

N, N -ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

20 からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

25 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$

¹ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim$

C₄アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N-(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基、N,N-ジ(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基、または-NHCOR⁹(ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

5

シアノ基、

-NR²⁰R²¹(ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁~C₄アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

10

N-(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基、

N,N-ジ(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基、

-NHCOR⁹(ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である)、および

ハロゲン原子

15

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そしてnは1から12の整数である) ;

からなる群より選択される基である。

20

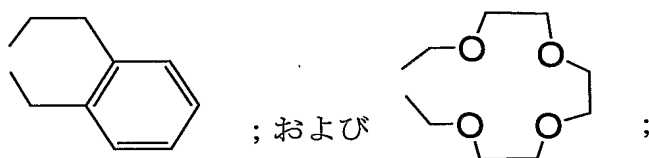
さらなる実施態様では、上記式(I)で表される化合物のR⁷およびR⁸はそれぞれ独立して、メチル基、エチル基、n-ブチル基、イソブチル基、n-デシル基、およびシクロヘキシル基からなる群より選択される基である。

なおさらなる実施態様では、上記式(I)で表される化合物のR⁷およびR⁸は同一である。

25

他の実施態様では、上記式(I)で表される化合物のR⁷およびR⁸は一緒になって、-(CH₂)_m-(ここで、mは2から8の整数である) ;

102

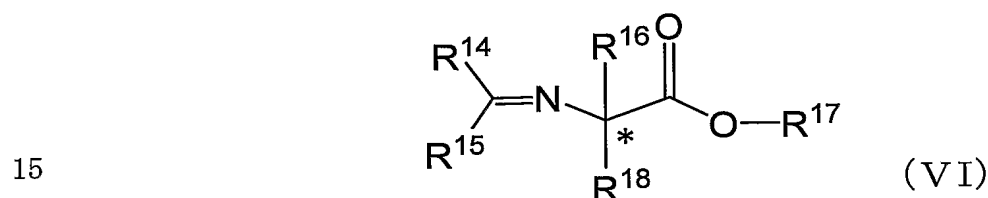


からなる群より選択される二価の基を表す。

- 5 1つの実施態様では、上記式 (I V) で表される化合物 1 モルに対し、上記式 (I) で表される化合物は、0.001 モル%から 0.1 モル%の割合で使用される。

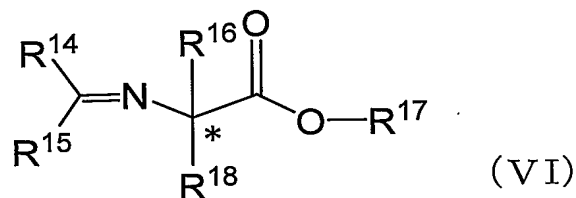
- 1つの実施態様では、上記式 (I V) で表される化合物 1 モルに対し、上記式 (I) で表される化合物は、0.005 モル%から 0.05 モル%の割合で使用される。

本発明はまた、光学活性な α -アミノ酸を製造するための方法を提供し、該方法は、上記方法により得られた式 (V I) で表される化合物：



(ここで、 R^{14} 、 R^{15} 、 R^{16} 、 R^{17} および R^{18} は上記に定義した基と同様である) のイミノ基 ($R^{14}R^{15}C=N-$) およびエステル基 ($-CO_2R^{17}$) を酸性条件下で加水分解する工程；を包含する。

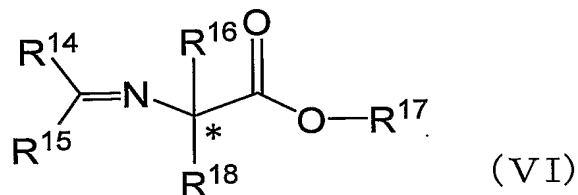
- 20 本発明はまた、光学活性な α -アミノ酸を製造するための別の方法を提供し、該方法は、上記方法により得られた式 (V I) で表される化合物：



(ここで、 R^{14} 、 R^{15} 、 R^{16} 、 R^{17} および R^{18} は上記に定義した基と同様

である) のイミノ基 ($R^{14}R^{15}C=N-$) を酸性条件下で加水分解する工程; および該酸性加水分解産物のエステル基 ($-CO_2R^{17}$) を酸性もしくは塩基性条件下で加水分解する工程; を包含する。

本発明はまた、光学活性な α -アミノ酸を製造するためのさらに別の方法を提供し、該方法は上記方法により得られた式 (VI) で表される化合物:



(ここで、 R^{14} 、 R^{15} 、 R^{16} 、 R^{17} および R^{18} は上記に定義した基と同様である) のエステル基 ($-CO_2R^{17}$) を塩基性条件下で加水分解する工程; および該塩基性加水分解産物のイミノ基 ($R^{14}R^{15}C=N-$) を酸性条件下で加水分解する工程; を包含する。

本発明によれば、より単純化された構造のキラル相間移動触媒が提供される。この相間移動触媒は、従来の化合物よりもより少ない工程により製造することができる。このように、より容易に提供され得る本発明の相間移動触媒は、例えば、 α -アルキル- α -アミノ酸誘導体および α 、 α -ジアルキル- α -アミノ酸の合成に利用され得る。

発明を実施するための最良の形態

以下、本明細書中で用いられる用語を定義する。

用語「分岐または環を形成していてもよい、 $C_1 \sim C_n$ のアルキル基」(ここで n は整数) は、炭素数 1 ~ n の任意の直鎖アルキル基、炭素数 3 ~ n の任意の分岐鎖アルキル基、および炭素数 3 ~ n の任意の環状アルキル基を包含する。例えば、炭素数 1 ~ 6 の任意の直鎖アルキル基としては、メチル、エチル、 n -プロピル、 n -ブチル、 n -ペンチル、および n -ヘキシルが

挙げられ、炭素数 3～6 の任意の分岐鎖アルキル基としては、イソプロピル、イソブチル、tert-ブチル、イソペンチルなどが挙げられ、そして炭素数 3～6 の任意の環状アルキル基としては、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシルなどが挙げられる。さらに、例えば、用語「分岐または環を形成していてもよく、および／またはハロゲン原子で置換されていてもよい、 $C_1 \sim C_{12}$ のアルキル基」という場合は、炭素数 1～12 の直鎖アルキル基、炭素数 3～12 の任意の分岐鎖アルキル基、および炭素数 3～12 の任意の環状アルキル基を包含し、これらの任意の位置の水素原子がハロゲン原子で置換されていてもよい。このようなアルキル基としては、n-ヘプチル、イソヘプチル、n-オクチル、イソオクチル、n-デシル、n-ドデシルなどが挙げられる。

なお、N- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基および N, N-ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイルにおいて、「 $C_1 \sim C_4$ アルキル」は、 $C_1 \sim C_4$ の直鎖アルキル基または $C_3 \sim C_4$ の分岐鎖アルキル基を意味する。

用語「分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_n$ のアルケニル基」(ここで n は整数) は、炭素数 2～n の任意の直鎖アルケニル基、炭素数 3～n の任意の分岐鎖アルケニル基、および炭素数 3～n の任意の環状アルケニル基を包含する。例えば、炭素数 2～6 の任意の直鎖アルケニル基としては、エテニル、1-プロペニル、2-プロペニル、1-ブテニル、2-ブテニル、1-ペンテニル、2-ペンテニル、3-ペンテニル、4-ペンテニル、1-ヘキセニルなどが挙げられ、炭素数 3～6 の任意の分岐鎖アルケニル基としては、イソプロペニル、1-メチル-1-プロペニル、1-メチル-2-プロペニル、2-メチル-1-プロペニル、2-メチル-2-プロペニル、1-メチル-2-ブテニル、などが挙げられ、そして炭素数 3～6 の任意の環状アルケニル基としては、シクロブテニル、シクロペンテニル、シクロヘキセニルなどが挙げられる。さらに、例えば、用語「分岐または環を形成し

ていてもよく、および／またはハロゲン原子で置換されていてもよい、 $C_2 \sim C_{12}$ のアルケニル基」という場合は、炭素数2～12の直鎖アルケニル基、炭素数3～12の任意の分岐鎖アルケニル基、および炭素数3～12の任意の環状アルケニル基を包含し、これらの任意の位置の水素原子がハロゲン原子で置換されていてもよい。このようなアルケニル基としては、1-ヘプテニル、2-ヘプテニル、1-オクテニル、1-デセニル、1-ドデセニルなどが挙げられる。

用語「分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_n$ のアルキニル基」（ここでnは整数）は、炭素数2～nの任意の直鎖アルキニル基、炭素数3～nの任意の分岐鎖アルキニル基、および炭素数3～nの任意の環状アルキニル基を包含する。例えば、炭素数2～6の任意の直鎖アルキニル基としては、エチニル、1-プロピニル、2-プロピニル、1-ブチニル、2-ブチニル、1-ペンチニル、1-ヘキシニルなどが挙げられ、炭素数3～6の任意の分岐鎖アルキニル基としては、1-メチル-2-プロピニルなどが挙げられ、そして炭素数3～6の任意の環状アルキニル基としては、シクロプロピルエチニル、シクロブチルエチニルなどが挙げられる。さらに、例えば、用語「分岐または環を形成していてもよく、および／またはハロゲン原子で置換されていてもよい、 $C_2 \sim C_{12}$ のアルキニル基」という場合は、炭素数1～12の直鎖アルキニル基、炭素数3～12の任意の分岐鎖アルキニル基、および炭素数3～12の任意の環状アルキニル基を包含し、これらの任意の位置の水素原子がハロゲン原子で置換されていてもよい。このようなアルキニル基としては、1-ヘプチニル、1-オクチニル、1-デシニル、1-ドデシニルなどが挙げられる。

用語「分岐していてもよい $C_1 \sim C_n$ のアルコキシ基」（ここでnは整数）は、炭素数1～nの任意の直鎖アルキル基を有するアルコキシ基および炭素数3～nの任意の分岐鎖アルキル基を有するアルコキシ基を包含する。例え

ば、メチルオキシ、エチルオキシ、 n -プロピルオキシ、イソプロピルオキシ、*tert*-ブチルオキシなどが挙げられる。

本発明において、用語「アラルキル基」の例としては、ベンジル、フェネチル、およびナフチルメチルが挙げられる。

- 5 本発明における用語「ヘテロアラルキル基」の例としては、ピリジルメチル、インドリルメチル、フリルメチル、チエニルメチル、およびピロリルメチルが挙げられる。

本発明において、用語「アリール基」の例としては、フェニル、ナフチル、アントリル、フェナントリルなどが挙げられる。

- 10 本発明における用語「ヘテロアリール基」の例としては、ピリジル、ピロリル、イミダゾリル、フリル、インドリル、チエニル、オキサゾリル、ベンゾチオフェニル-2-イル、チアゾリル、3, 4-メチレンジオキシフェニル、3, 4-エチレンジオキシフェニル、およびテトラゾリルが挙げられる。

- 15 本発明において、用語「ハロゲン原子」の例としては、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子およびフッ素原子が挙げられる。なお、本発明において、用語「ハロゲン化物アニオン」とは、ハロゲンイオンのことを意味し、塩化物イオン、臭化物イオン、ヨウ化物イオン、およびフッ化物イオンが挙げられる。

- 20 本発明において、用語「分岐または環を形成していてもよい、 $C_3 \sim C_n$ のアリル基または置換アリル基」（ここで n は整数）は、アリル基、あるいは1および/または2および/または3位に置換基を有する任意の合計炭素数4 $\sim n$ の置換アリル基を意味する。例えば、2-ブテニル、1-シクロペンテニルメチル、3-メチル-2-ブテニルなどが挙げられる。

- 25 本発明において、用語「分岐していてもよい、 $C_3 \sim C_n$ のプロパルギル基または置換プロパルギル基」（ここで n は整数）は、プロパルギル基、あるいは1および/または3位に置換基を有する任意の合計炭素数4 $\sim n$ の置換

プロパルギル基を意味する。例えば、2-ブチニル、3-トリメチルシリル-2-プロピニルなどが挙げられる。

本発明において、用語「脱離能を有する官能基」は、置換反応または脱離反応などにおいて、反応基質から離れていく原子または原子団、すなわち脱離基を意味する。例えば、ハロゲン原子、スルホニルオキシ基などが挙げられる。

なお、本明細書において、便宜上、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

10 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、 N 、 N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

20 カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

N 、 N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

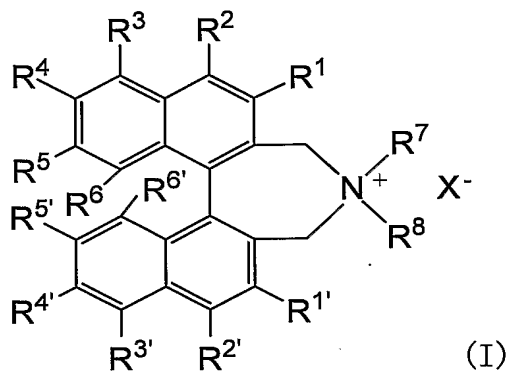
25 ハロゲン原子

からなる群を、群(Q)と記載する場合がある。

以下、本発明について詳述する。

本発明の4級アンモニウム塩は、軸不斉に関して純粋であり、以下の式

(I) :



(ここで、

R^1 、 $R^{1'}$ 、 R^2 、 $R^{2'}$ 、 R^3 、 $R^{3'}$ 、 R^4 、 $R^{4'}$ 、 R^5 、 $R^{5'}$ 、 R^6 および
 $R^{6'}$ は、それぞれ独立して、

(i)水素原子；

(ii) $-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水
 素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)；

(iii)シアノ基；

(iv)ニトロ基；

(v)カルバモイル基；

(vi) $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基；

(vii) N, N -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基；

(viii) $-NHCO R^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アル
 キル基である)；

(ix)分岐または環を形成していてもよい、 $C_1 \sim C_6$ のアルキル基；

(x)分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$ のアルケニル基；

(xi)分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$ のアルキニル基；

(xii)アラルキル基であって、ここで、該アラルキル基を構成するアリー

ル部分が、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$

5 (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、 N,N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

10 シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

15 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

N,N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

20 からなる群(Q)より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アラルキル基；

(xiii)ヘテロアリール部分を有するヘテロアラルキル基であって、ここで、該ヘテロアリール部分が、上記群(Q)より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアラルキル基；

25 (xiv)アリール基であって、ここで、該アリール基が、上記群(Q)より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、あるいは3, 4

位が一緒になって $-O-(CH_2)_m-O-$ (ここで、 m は 1 または 2 である) で置換されていてもよい、アリール基 ; ならびに

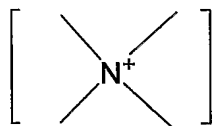
(xv) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が、上記群 (Q) より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基 ;

からなる群より選択される基であり、

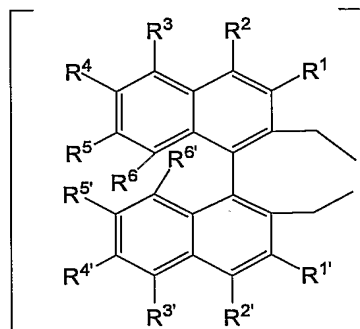
R^7 および R^8 はそれぞれ独立して、一価の有機基であるか、あるいは一緒になって二価の有機基を表し、そして

X^- は、ハロゲン化物アニオン、 SCN^- 、 HSO_4^- 、または HF_2^- である) で表される化合物である。上記式 (I) で表される化合物は、(S) または (R) のいずれの立体配置を有していてもよい。

上記式 (I) で表される化合物は、例えば、後述する光学活性な α -アミノ酸またはその誘導体、特に、 α 、 α -ジアルキル- α -アミノ酸またはその誘導体を製造するための相間移動触媒として有用に機能する。より具体的には、式 (I V) で表される化合物を式 (V) で表される化合物でアルキル化して式 (V I) で表される光学活性な α -アミノ酸またはその誘導体を製造するために、上記式 (I) で表される化合物を相間移動触媒として用いる場合、当該化合物のカチオンを構成するアンモニウム部分 :



が、該アルキル化における反応性に寄与し、かつビナフチル部分 :



が、該アルキル化反応の立体選択性に寄与する。したがって、式 (I) で表される化合物における R^7 および R^8 は、1つの実施態様においては、上記カチオンのアンモニウム部分とビナフチル部分とに由来する反応性および選択性を保持し得る（あるいは、これらの反応性および選択性を阻害しない）基である。例えば、上記アンモニウム部分およびビナフチル部分と比較して不活性な一価の有機基または二価の有機基であり得る。言い換えれば、 R^7 および R^8 は、それら自体（またはそれ自体）が反応性に富む基ではなく、後述するアミノ酸またはその誘導体の製造における反応に影響を及ぼさない基である。あるいは、上記式 (I) において、 R^7 および R^8 は、それぞれ独立して

(i) 分岐または環を形成していてもよく、および／またはハロゲン原子で置換されていてもよい、 $C_1 \sim C_{12}$ のアルキル基；

(ii) 分岐または環を形成していてもよく、および／またはハロゲン原子で置換されていてもよい、 $C_2 \sim C_{12}$ のアルケニル基；

(iii) 分岐または環を形成していてもよく、および／またはハロゲン原子で置換されていてもよい、 $C_2 \sim C_{12}$ のアルキニル基；

(iv) アリール基であって、該アリール基が、上記群 (Q) より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基；

(v) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が、上記群 (Q) より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基；

(vi) $-(CH_2)_n OCONR^{10}R^{11}$ （ここで、 R^{10} および R^{11} は、それぞれ独立して、

(1) 水素原子、

(2) 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

(3) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$ のアルケニル基；

(4)分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$ のアルキニル基；

(5)アラルキル基であって、該アラルキル基を構成するアリール部分が、上記群（Q）より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アラルキル基；

5 (6)ヘテロアリール部分を有するヘテロアラルキル基であって、該ヘテロアリール部分が、上記群（Q）より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアラルキル基；

(7)アリール基であって、該アリール基が、上記群（Q）より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

10 (8)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が、上記群（Q）より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、
からなる群より選択される基であり、そしてnは1から12の整数である）；

15 (vii) $-(CH_2)_n CONR^{12}R^{13}$ （ここで、 R^{12} および R^{13} は、それぞれ独立して、

(1)水素原子、

(2)分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

20 (3)アリール基であって、該アリール基が、上記群（Q）より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が、上記群（Q）より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

25 からなる群より選択される基であり、そしてnは1から12の整数である）；

(viii) $-(CH_2)_n NR^{12}COR^{13}$ （ここで、 R^{12} および R^{13} は、それ

それぞれ独立して、

(1)水素原子、

(2)分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

(3)アリール基であって、該アリール基が、上記群(Q)より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が、上記群(Q)より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そしてnは1から12の整数である) ;

(ix) — $(CH_2)_n NR^{12} R^{13}$ (ここで、 R^{12} および R^{13} は、それぞれ独立して、

(1)水素原子、

(2)分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

(3)アリール基であって、該アリール基が、上記群(Q)より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が、上記群(Q)より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そしてnは1から12の整数である) ;

(x) — $(CH_2)_n Y - OR^{12}$ (ここで、Yは分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ の二価の飽和炭化水素基であり、 R^{12} は、

(1)水素原子、

(2)分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

(3)アリール基であって、該アリール基が、上記群(Q)より選択さ

れる少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が、上記群 (Q) より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

5 かなる群より選択される基であり、そして n は1から12の整数である) ;

(xi) $-(CH_2)_n-OR^{12}$ (ここで、 R^{12} は、

(1) 水素原子、

(2) 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

10 (3) アリール基であって、該アリール基が、上記群 (Q) より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が、上記群 (Q) より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

15 かなる群より選択される基であり、そして n は1から12の整数である) ;

(xii) $-(CH_2)_n-S-R^{12}$ (ここで、 R^{12} は、

(1) 水素原子、

(2) 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

20 (3) アリール基であって、該アリール基が、上記群 (Q) より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が、上記群 (Q) より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

25 かなる群より選択される基であり、そして n は1から12の整数である) ;

(xiii) — (CH₂)_n — SO — R¹² (ここで、R¹²は、

(1) 水素原子、

(2) 分岐していてもよい C₁ ~ C₄ アルキル基、

(3) アリール基であって、該アリール基が、上記群 (Q) より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が、上記群 (Q) より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そして n は 1 から 12 の整数である) ; ならびに

(xiv) — (CH₂)_n — SO₂ — R¹² (ここで、R¹²は、

(1) 水素原子、

(2) 分岐していてもよい C₁ ~ C₄ アルキル基、

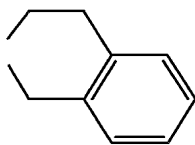
(3) アリール基であって、該アリール基が、上記群 (Q) より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が、上記群 (Q) より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

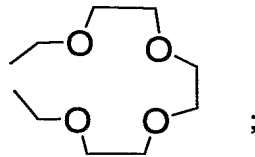
からなる群より選択される基であり、そして n は 1 から 12 の整数である) ;

からなる群より選択される (一価の有機) 基であるか、あるいは、

R⁷ および R⁸ は一緒になって、— (CH₂)_m — (ここで、m は 2 から 8 の整数である) ;



; および



;

からなる群より選択される（二価の有機）基である。

本発明においては、上記式（I）において、 R^1 、 $R^{1'}$ 、 R^2 、 $R^{2'}$ 、 R^3 、 $R^{3'}$ 、 R^4 、 $R^{4'}$ 、 R^5 、 $R^{5'}$ 、 R^6 および $R^{6'}$ は、好ましくは、それぞれ独立して、

5 (i)水素原子；

(xiv)アリール基であって、ここで、該アリール基が、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$

10 (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、 N 、 N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ （ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である）で置換されていてもよい、アリール基、

15 シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ （ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である）、

ニトロ基、

カルバモイル基、

20 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

N 、 N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ （ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である）、

ハロゲン原子および

25 $-S(O)_n-R$ （ここで、 n は0、1または2であり、そして R は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である）；

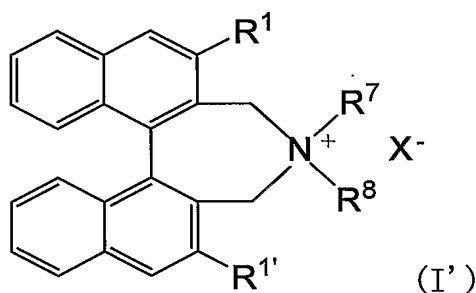
からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、あるいは3, 4位が一緒になって $-O-(CH_2)_m-O-$ (ここで、 m は1または2である)

で置換されていてもよい、アリール基；ならびに

- 5 (xv) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が
- 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、
- 分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、
- 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$
- (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$
- 10 C_4 アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、 N, N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、
- シアノ基、
- 15 $-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、
- ニトロ基、
- カルバモイル基、
- $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、
- 20 N, N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、
- $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および
- ハロゲン原子

- からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘ
- 25 テロアリール基；からなる群より選択され、より好ましくは、水素原子、3, 4, 5-トリフルオロフェニル基、3, 4, 5-トリクロロフェニル基、3,

4-ジフルオロフェニル基、3-ニトロフェニル基、3-シアノフェニル基、
 ベンゾチオフェニル-2-イル基、3, 5-ジフルオロフェニル基、3-トリ
 フルオロメチルフェニル基、2, 4-ジフルオロフェニル基、3-メチル
 スルホニルフェニル基、および2, 3-ビス(トリフルオロメチル)フェニ
 5 ル基からなる群より選択される。特に、上記式(I)で表される化合物のう
 ち、以下の式(I') :



(ここで、 R^1 および $R^{1'}$ は、それぞれ独立して、水素原子、3, 4, 5-
 トリフルオロフェニル基、3, 4, 5-トリクロロフェニル基、3, 4-ジ
 フルオロフェニル基、3-ニトロフェニル基、3-シアノフェニル基、ベン
 15 ゾチオフェニル-2-イル基、3, 5-ジフルオロフェニル基、3-トリフ
 ルオロメチルフェニル基、2, 4-ジフルオロフェニル基、3-メチルスル
 ホニルフェニル基、および2, 3-ビス(トリフルオロメチル)フェニル基
 からなる群より選択される基であり、そして R^7 、 R^8 および X^- は、それぞ
 れ独立して、上で定義される基である)で表される化合物が好ましい。

20 また、上記式(I)で表される化合物の R^7 および R^8 は、好ましくは、そ
 れぞれ独立して、

(ii)分岐または環を形成していてもよい、 $C_1 \sim C_{12}$ のアルキル基；なら
 びに

(xii) $-(CH_2)_n-OR^{12}$ (ここで、 R^{12} は、

25 (1)水素原子、

(2)分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

(3) アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$

5 1 (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、 N,N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、または $-NHCO R^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

10 シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

15 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

N,N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

$-NHCO R^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

20 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

25 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$

1 (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim$

C₄アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N-(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基、N,N-ジ(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基、または-NHCOR⁹(ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

5 シアノ基、

-NR²⁰R²¹(ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁~C₄アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

10 N-(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基、

N,N-ジ(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基、

-NHCOR⁹(ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である)、および

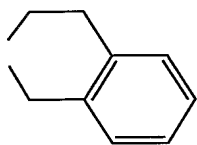
ハロゲン原子

15 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

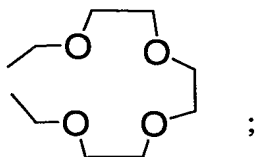
からなる群より選択される基であり、そしてnは1から12の整数である) ;

20 からなる群より選択される基であり、より好ましくは、メチル基、エチル基、n-ブチル基、イソブチル基、n-デシル基、およびシクロヘキシル基からなる群より選択される。さらに、R⁷およびR⁸は同一であることが好ましく、あるいは、R⁷およびR⁸が一緒になって、-(CH₂)_m-(ここで、mは2から8の整数である) ;

25

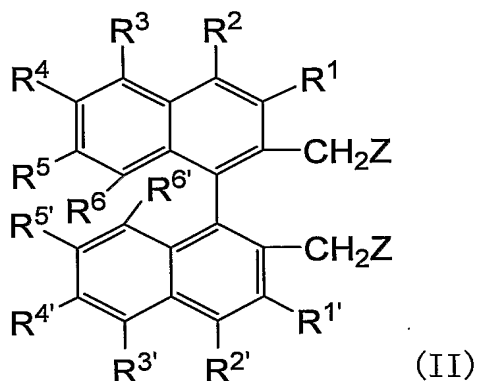


; および



からなる群より選択される二価の基である化合物も好ましい。

上記式 (I) で表される 4 級アンモニウム塩は、以下の式 (II) :

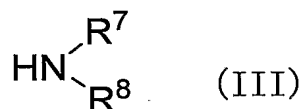


10 (ここで、 R^1 、 $R^{1'}$ 、 R^2 、 $R^{2'}$ 、 R^3 、 $R^{3'}$ 、 R^4 、 $R^{4'}$ 、 R^5 、 $R^{5'}$ 、 R^6 および $R^{6'}$ は、上記式 (I) において定義されたものと同様であり、そして

Zはハロゲン原子である)

で表される化合物を、有機溶媒中、酸捕捉剤の存在下にて、

15 以下の式 (III) :

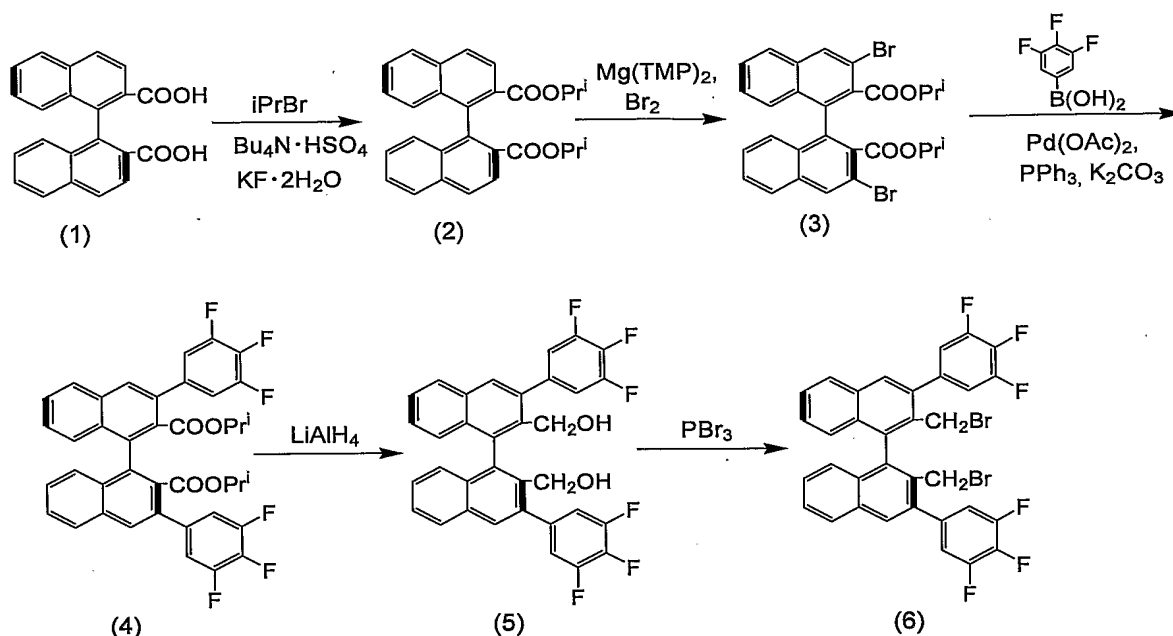


(ここで、 R^7 および R^8 は、上記式 (I) において定義されたものと同様である)

20 で表される 2 級アミンと反応させることによって製造することができる。

上記式 (II) の化合物は、例えば、容易に入手可能な 1, 1'-ビナフチル-2, 2'-ジカルボン酸 (Seki, M. ら, Synthesis, 2000年, p.1677 参照) から、以下のスキーム 1 に記載のような公知の工程で容易に調製され得る (Ooi, T. ら, J. Org. Chem., 2003年, 68巻, p.4577参照)。1, 1'-ビナフチル-2, 2'-ジカルボン酸は、(S) 体または (R) 体のいずれであってもよい。

25



スキーム1

上記スキーム1に基づいて具体的に説明する。まず、ジカルボン酸(1)を、臭化イソプロピル、触媒 $\text{Bu}_4\text{N} \cdot \text{HSO}_4$ 、および $\text{KF} \cdot 2\text{H}_2\text{O}$ を用いて、対応するジイソプロピルエステル(2)に変換する。得られた化合物(2)を、ビス(2,2,6,6-テトラメチルピペラミド)マグネシウム(以下、 $\text{Mg}(\text{TMP})_2$ という)で処理し、続いて Br_2 を添加して、3,3'-ジブromo-1,1'-ジナフチル-2,2'-ジカルボン酸エステル(3)を得る。次いで、酢酸パラジウム、トリフェニルホスフィン、および炭酸カリウムの存在下で、得られた化合物(3)と3,4,5-トリフルオロフェニルボロン酸とのSuzuki-Miyauraの交差カップリング反応を行って、3,3'-ビス(3,4,5-トリフルオロフェニル)-1,1'-ビナフチル-2,2'-ジカルボン酸エステル(4)を得る。さらに、この(4)を LiAlH_4 で還元して得られたアルコール(5)を PBr_3 で処理して、上記式(II)に相当するジブロミド(6)を得ることができる。

一方、上記式(III)の2級アミンは、市販されているものが多く、入

手が容易であるため、適宜選択することができる。

上記式 (I I) の化合物に上記式 (I I I) の化合物を反応させて上記式 (I) の化合物を製造する工程に用いられる有機溶媒としては、ニトリル系溶媒 (例えば、アセトニトリル、プロピオニトリルなど)、エーテル系溶媒 (例えば、ジオキサン、テトラヒドロフラン、イソプロピルエーテル、ジエチルエーテル、ジメトキシエタン、2-メトキシエチルエーテルなど)、アルコール系溶媒 (例えば、メタノール、エタノール、*n*-プロパノール、イソプロパノール、*n*-ブタノール、*tert*-ブタノールなど) などが挙げられる。本発明においては、特に、アセトニトリルが好ましい。酸捕捉剤としては、炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素カリウム、炭酸水素ナトリウムなどの無機塩基が挙げられる。

上記反応において、式 (I I I) の2級アミンは、式 (I I) の化合物に対して好ましくは1~4当量、より好ましくは2~3当量用いられる。酸捕捉剤は、式 (I I) の化合物に対して好ましくは1~4当量、より好ましくは約1~2当量用いられる。式 (I I) の化合物と式 (I I I) の2級アミンとは、酸捕捉剤の存在下で、適切な有機溶媒中、攪拌しながら反応させる。反応温度は、好ましくは、室温から有機溶媒の沸点までであり、より好ましくは加熱還流下で反応が行われる。反応時間は、好ましくは30分~24時間、より好ましくは6~12時間である。このとき、有機溶媒は、式 (I I) の化合物に対して容積 (mL) / 重量 (g) 比で、好ましくは5~50倍、より好ましくは5~30倍の量を用いる。反応終了後、反応混合物を、ジクロロメタン、ジクロロエタン、四塩化炭素などによる抽出、シリカゲルカラムクロマトグラフィーなどによって単離・精製して、式 (I) の化合物を得ることができる。あるいは、反応混合物を、そのまま以下に詳述する α -アミノ酸誘導体の製造方法に相間移動触媒として使用してもよい。

このようにして得られた X^- がハロゲン化物アニオンである式 (I) の化

合物は、軸不斉に関して純粋な形態であり、相間移動触媒として使用され得る。ここで、「軸不斉に関して純粋」とは、軸不斉に基づいて考えられる立体異性体のうち、1つの特定の異性体の存在率が、他の異性体より多いことをいう。好ましくは、当該1つの特定の異性体の存在率は、90%以上、より好ましくは95%以上、さらにより好ましくは98%以上である。

さらに、上記 X^- がハロゲン化物アニオンである式(I)の化合物は、例えば、以下の工程を経て、ハロゲン化物アニオンが SCN^- 、 HSO_4^- 、または HF_2^- に変換された化合物とすることができる。

まず、 X^- が SCN^- または HSO_4^- である式(I)の化合物の製造方法について説明する。

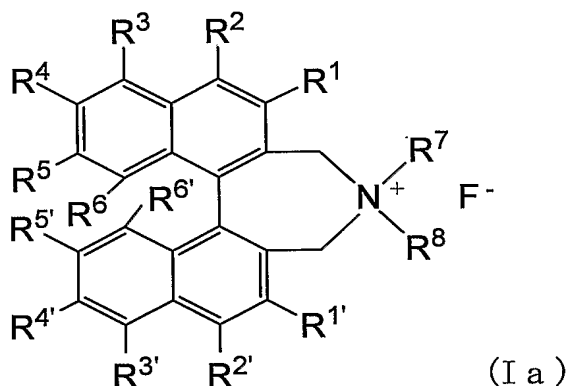
上記のようにして得られた X^- がハロゲン化物アニオンである式(I)の化合物は、特開2002-173492号公報に記載の方法に準じて、例えば、適切な第二の有機溶媒中に溶解し、チオシアン酸アルカリ金属塩の飽和水溶液と混合することにより、 X^- であるハロゲン化物アニオンが、 SCN^- に変換される。

この交換において使用可能な第二の有機溶媒の例としては、ジクロロメタン、クロロホルム、ジクロロエタン、テトラヒドロフラン、メチルtertブチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、および酢酸エチルが挙げられる。チオシアン酸アルカリ金属塩の例としては、チオシアン酸カリウムおよびチオシアン酸ナトリウムが挙げられる。

X^- がハロゲン化物アニオンである式(I)の化合物と、チオシアン酸アルカリ金属塩との反応は、例えば、室温のような比較的温和な条件下の溶液中で混合接触することにより、容易に進行し、反応生成物（すなわち、 X^- が SCN^- である式(I)の化合物を定量的収率で得ることができる。

また、上記 X^- が SCN^- である式(I)の化合物は、濃硝酸と反応させることにより、 X^- が SCN^- から、さらに HSO_4^- へと容易に変換される。

このようにして得られた X^- が HSO_4^- である式 (I) の化合物は、さらにフッ化アルカリ金属塩（例えば、フッ化カリウム、フッ化ナトリウム、またはフッ化リチウム）と反応させることによって、例えば、シリルエノールエーテルとカルボニル化合物との反応（アルドール反応）における触媒として利用可能な式 (I a) :



（ここで、 R^1 、 $R^{1'}$ 、 R^2 、 $R^{2'}$ 、 R^3 、 $R^{3'}$ 、 R^4 、 $R^{4'}$ 、 R^5 、 $R^{5'}$ 、 R^6 および $R^{6'}$ は、上記式 (I) において定義されたものと同様である）で表される化合物を得ることもできる。

上記アルドール反応において使用されるシリルエノールエーテルは、例えば、トリルアルキルシリルエノールエーテルである。トリルアルキルシリルエノールエーテルは、トリメチルシリルクロリド、トリエチルシリルクロリドなどのクロロシランを、塩基の存在下にてカルボニル化合物（例えば、2-ブタノン、4-ペンテン-2-オン、ジエチルケトン、アセトフェノン、プロピオフェノン、ブチロナフトン、シクロキシヘサノン、1-オキソインダン、1-テトラロン、または2-テトラロンのようなケトン誘導体）と反応させることにより予め調製され得る。

上記アルドール反応において使用されるシリルエノールエーテルと反応するカルボニル化合物には、シリルエノールエーテルの前駆体であるカルボニル化合物（上記ケトン誘導体）に加えて、アセチルアルデヒド、プロピオン

アルデヒド、ブチルアルデヒド、イソブチルアルデヒド、イソバレルアルデヒド、カプロンアルデヒド、ドデシルアルデヒド、パルミチンアルデヒド、ステアリンアルデヒド、アクロレイン、クロトンアルデヒド、シクロヘキサンカルブアルデヒド、ベンズアルデヒド、アニスアルデヒド、ニコチンアルデヒド、シンナムアルデヒド、 α -ナフトアルデヒド、 β -ナフトアルデヒドなどのアルデヒド化合物が挙げられる。

このようなシリルエノールエーテルおよびカルボニル化合物に対し、式 (I a) で表される化合物は、上記アルドール反応の触媒として使用され、当該反応の立体選択性を制御することができる。

次に、 X^- が HF_2^- である式 (I) の化合物の製造方法について説明する。

上記のようにして得られた X^- がハロゲン化物アニオンである式 (I) の化合物は、まず、イオン交換樹脂と接触させられ、第一の中間体が生成される。

上記イオン交換樹脂は、当業者によって任意のものが選択可能である。使用可能なイオン交換樹脂の具体的な例としては、アンバーリスト A 26 (OH) (オルガノ社製) が挙げられる。

X^- がハロゲン化物アニオンである式 (I) の化合物とイオン交換樹脂との接触は、例えば、上記 X^- がハロゲン化物アニオンである式 (I) の化合物を適切な第三の溶媒に溶解し、この溶液を当該イオン交換樹脂を充填したカラムに通すことにより行われる。このような接触を行う際に使用され得る第三の溶媒はアルコール溶媒が好ましい。アルコール溶媒の具体的な例としては、メチルアルコール、エチルアルコール、イソプロピルアルコール、およびノルマルプロピルアルコールが挙げられるが、特にこれらに限定されない。

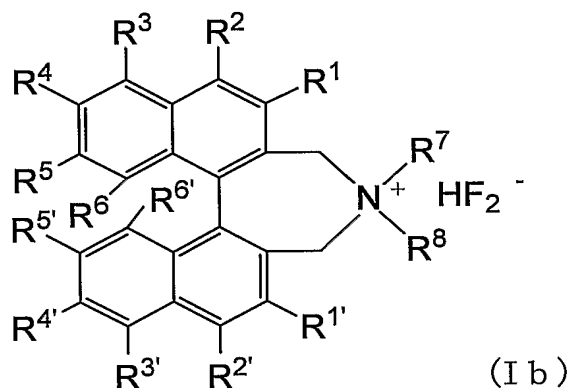
この接触において使用される上記 X^- がハロゲン化物アニオンである式 (I) の化合物および第三の溶媒の量は、特に限定されず、当業者によって

適切に設定され得る。

このようにして、第一の中間体が生成される。

次いで、得られた第一の中間体は、好ましくは上記溶媒を除去することなく、フッ化水素水溶液と中和させられる。

5 本発明に用いられるフッ化水素水溶液の使用量は、特に限定されないが、生産性を高める点から、好ましくは、上記で使用した X^- がハロゲン化物アニオンである式(I)の化合物に対して等量以上のフッ化水素が反応するように選択される。これにより、第一の中間体が中和され、溶液中に、 X^- がハロゲン化物アニオンから、さらに HF_2^- へと変換された式(Ib)：



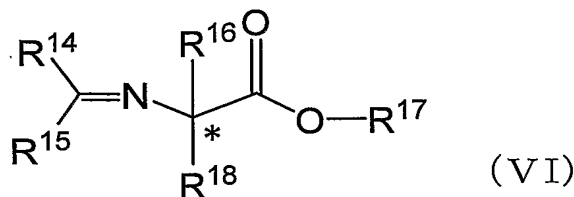
で表される化合物を沈殿させることができる。

その後、この式(Ib)の化合物は、当業者が通常用いる手段を用いて溶媒を除去することにより、容易に単離され得る。

20 このようにして得られた、式(Ib)の化合物は、例えば、ジアステレオ選択的かつエナンチオ選択的に制御されたニトロアルコールを生成するための触媒としても利用され得る。

次に、式(I)で表される本発明の4級アンモニウム化合物を相間移動触媒として用いて、 α -アミノ酸誘導体を製造する方法について説明する。

25 式(VI)で表される α -アミノ酸誘導体：



(ここで、

5 R^{14} および R^{15} は、それぞれ独立して、

(i)水素原子；あるいは

(ii)分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基か、分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基か、またはハロゲン原子かで置換されていてもよい、アリール基；

10 であり、ただし R^{14} および R^{15} がともに水素原子である場合を除き、

R^{16} は、

(i)水素原子；

(ii)分岐または環を形成していてもよい、 $C_1 \sim C_{10}$ のアルキル基；

(iii)分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$ のアルケニル基；

15 (iv)分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$ のアルキニル基；

(v)アラルキル基であって、該アラルキル基を構成するアリール部分が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$

20 (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、 N,N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

25 シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素

原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N-($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

5 N, N-ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

-NHCO R^9 (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群(Q)より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよ

10 い、アラルキル基;

(vi) ヘテロアリール部分を有するヘテロアラルキル基であって、該ヘテロアリール部分が、上記群(Q)より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアラルキル基;

(vii) アリール基であって、該アリール基が、上記群(Q)より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基; ならびに

15 (viii) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が、上記群(Q)より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基;

からなる群より選択される基であり、

20 R^{17} は、分岐または環を形成していてもよい $C_1 \sim C_8$ アルキル基であり、

R^{18} は、

(i) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル基;

(ii) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_3 \sim C_9$ のアリル基または置換アリル基;

25 (iii) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$ のアルケニル基;

(iv) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$ のアルキニル基;

(v) アラルキル基であって、該アラルキル基を構成するアリール部分が、上記群 (Q) より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、アラルキル基；

5 (vi) ヘテロアリール部分を有するヘテロアラルキル基であって、該ヘテロアリール部分が、上記群 (Q) より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、ヘテロアラルキル基；

(vii) アリール基であって、該アリール基が、上記群 (Q) より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、アリール基；

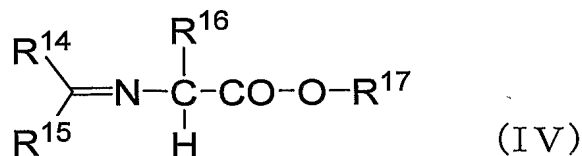
10 (viii) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が、上記群 (Q) より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基；ならびに

(ix) 分岐していてもよい、 $C_3 \sim C_9$ のプロパルギル基または置換プロパルギル基；

からなる群より選択される基であり、そして

15 * は、新たに生成する不斉中心を示す) は、

式 (IV) で表される化合物：



20 (ここで、 R^{14} 、 R^{15} 、 R^{16} 、および R^{17} 、上記式 (VI) において定義されたものと同様である)

を、媒体中、無機塩基の存在下、上記式 (I) で表される化合物を相間移動触媒として用いて、式 (V) の化合物：



25 (ここで、 R^{18} は、上記式 (VI) において定義されたものと同様であり、そして W は、脱離能を有する官能基である) でアルキル化する工程によって、

立体選択的に製造することができる。

この工程で用いられる媒体としては、ベンゼン、トルエン、キシレン、エチルエーテル、イソプロピルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンなどが挙げられる。あるいは、媒体は、これらのうちの水と混ざらない媒体と水との二相系媒体であってもよい。媒体は、式 (I V) の化合物に対して容積 (mL) / 重量 (g) 比で好ましくは 5 ~ 30 倍、より好ましくは 8 ~ 25 倍を使用し得る。

この工程で用いられる無機塩基としては、水酸化リチウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化カルシウム、水酸化ルビジウム、水酸化セシウムなどが挙げられる。無機塩基は、式 (I V) の化合物に対して好ましくは 2 ~ 10 当量、より好ましくは 3 ~ 7 当量を使用し得る。無機塩基は、10 0 ~ 60 w / v % のアルカリ水溶液として用いてもよく、その場合の容量は、式 (I V) の化合物に対して容積 (mL) / 重量 (g) 比で好ましくは 4 ~ 20 倍、より好ましくは 8 ~ 15 倍であり得る。

上記アルキル化工程において、式 (V) の化合物は、式 (I V) の化合物に対して、好ましくは 1 ~ 1.5 当量、より好ましくは 1.1 ~ 1.3 当量、さらにより好ましくは 1.2 ~ 1.25 当量用いる。式 (I) の化合物は、式 (I V) の化合物 1 モルに対して、好ましくは 0.001 モル% ~ 0.1 モル%、より好ましくは 0.005 モル% ~ 0.05 モル% を相間移動触媒として用いる。このように本発明に用いられる相間移動触媒は、その活性自体が非常に高いため、式 (I V) の化合物 1 モルに対して極めて少量を使用することのみで、所望の光学活性な α -アミノ酸およびその誘導体を得ることができる。

また、本発明においては、このような相間移動触媒に加え、反応系内にテトラブチルアンモニウムブロミド (TBAB) のようなアキラルな 4 級アンモニウム塩を併用させてもよい。例えば、TBAB は本発明における反応系

において、助触媒として機能し、得られる α -アミノ酸およびその誘導体の収率を向上させるとともに、本発明に用いられる式(I)で表される相間移動触媒の使用量をより低減させることができる。本発明において使用され得るTBABの量は、上記式(IV)の化合物1モルに対し、好ましくは0.

5 005モル%~0.1モル%であり、より好ましくは0.01%~0.06モル%である。

上記アルキル化工程はまた、 -30°C から室温までの間の適切な温度、好ましくは -20°C ~ 0°C で、空气中、好ましくはアルゴン雰囲気下にて行われる。この工程は、アルキル化反応が十分に進行するまで適切な時間にわたって、攪拌しながら行われ得る。反応時間は、好ましくは30分~48時間、より好ましくは1時間~24時間である。

上記のような本発明の式(I)の化合物を用いる本発明の方法によれば、光学活性な式(VI)の化合物を、高収率かつ高光学純度で得ることができる。ここで、高光学純度とは、80%ee以上、好ましくは85%ee以上、より好ましくは90%ee以上、さらに好ましくは95%ee以上の光学純度であることをいう。

本発明の別の局面では、本発明は、光学活性な α -アミノ酸の製造方法を提供する。

すなわち、本発明においては、上記の方法により得られた光学活性な式(VI)の化合物(光学活性な α -アミノ酸誘導体)を用いて、例えば、以下のいずれかの手順を行うことにより、光学活性な α -アミノ酸を製造することができる。

第一の方法では、まず、上記の方法により得られた光学活性な式(VI)の化合物(光学活性な α -アミノ酸誘導体)を構成するイミノ基($\text{R}^{14}\text{R}^{15}\text{C}=\text{N}-$)部分が酸性条件下で加水分解される(イミンの酸性加水分解工程)。このイミンの酸性加水分解工程に用いられる酸の例としては、無機酸

(例えば、塩酸またはリン酸)あるいは3塩基酸を含む有機酸(例えば、酢酸、クエン酸)が挙げられる。このイミンの酸性加水分解工程は、具体的には、適切な媒体(例えば、テトラヒドロフランまたはトルエン)中、式(V I)の化合物を、上記酸の水溶液を用いて適切な温度(例えば、室温)にて

5 処理することによって進行する。その結果、酸性加水分解産物として末端アミノ基が遊離したアミノ酸のエステル誘導体を得ることができる。

次いで、上記の工程で得られたアミノ酸のエステル誘導体(酸性加水分解産物)は、必要に応じて、イミンの加水分解よりも強い酸性条件もしくは塩基性条件下、加水分解反応に供せられる。これにより、当該酸性加水分解物の

10 末端(すなわち、当該酸性加水分解産物を構成するエステル基($-\text{CO}_2\text{R}^{17}$))がカルボン酸となった目的のアミノ酸を得ることができる。

あるいは、第二の方法では、上記と反対の工程が採用される。すなわち、上記のアルキル化反応によって得られた光学活性な式(V I)の化合物(光学活性な α -アミノ酸誘導体)を構成するエステル基($-\text{CO}_2\text{R}^{17}$)を、

15 塩基性条件下に最初に加水分解する(エステルの塩基性加水分解工程)。このエステルの塩基性加水分解工程には、水酸化ナトリウム水溶液などのアルカリ水溶液が用いられ得る。このような加水分解を行うことにより、式(V I)の化合物の末端(すなわち、当該式(V I)の化合物を構成するエステル基($-\text{CO}_2\text{R}^{17}$))がカルボン酸となった塩基性加水分解産物を得ること

20 ができる。

次いで、上記で得られた塩基性加水分解産物のイミノ基($\text{R}^{14}\text{R}^{15}\text{C}=\text{N}-$)部分を酸性条件下に加水分解する(イミンの酸性加水分解工程)。このイミンの酸性加水分解工程に用いられる酸の例としては、無機酸(例えば、塩酸、リン酸、硫酸)あるいは3塩基酸を含む有機酸(例えば、酢酸、クエン酸)が挙げられる。このイミンの酸性加水分解工程は、具体的には、適切な媒体(例えば、テトラヒドロフランまたはトルエン)中、上記塩基性加水

25

分解産物を、上記酸の水溶液を用いて適切な温度（例えば、室温）で処理することによって進行する。その結果、末端アミノ基が遊離した目的のアミノ酸を得ることができる。

本発明においては、式（V I）の化合物からアミノ酸を製造する場合、上記第一の方法または第二の方法のいずれが用いられてもよく、実際に製造するアミノ酸の具体的な構造その他製造条件によって当業者が任意に選択することができる。

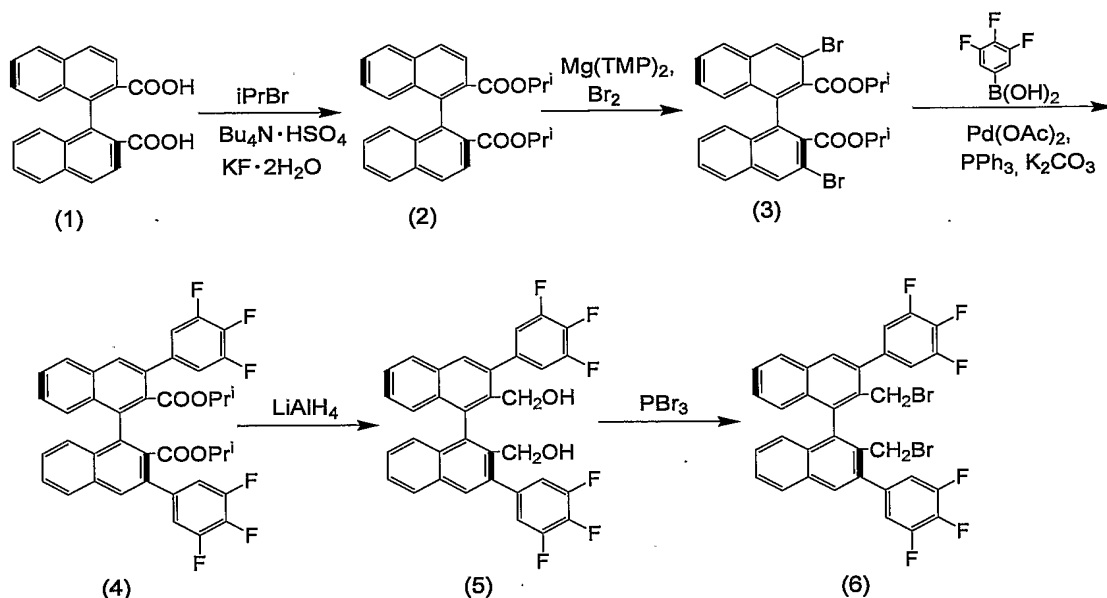
このようにして、所望の光学活性な α -アミノ酸を、その構造上の制約を受けることなく、効率的かつ任意に製造することができる。

実施例

以下、本発明を実施例によって具体的に記述するが、これらによって本発明は制限されるものではない。

なお、以下の実施例においては、 ^1H NMRスペクトルを、JEOL JNM-FX400（400MHz）スペクトロメータ、およびJMT-C-400/54/SS（400MHz）スペクトロメータで測定した。反応生成物の光学純度は、高速液体クロマトグラフィー（HPLC）を、4.6mm \times 25cm Daicel Chiralcel OD、OD-H、AD、またはAD-Hを用いて、Shimadzu 10装置で測定した。反応の進行は、薄層クロマトグラフィー（TLC）は、Merck precoated TLCプレート（シリカゲル60 GF254, 0.25mm）を用いてモニタリングした。

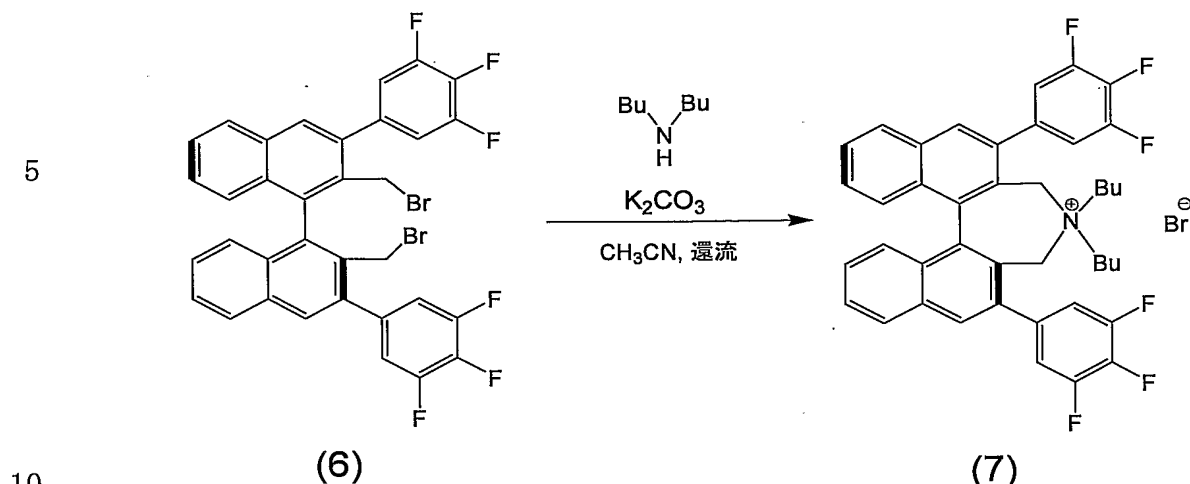
<参考例1：4級アンモニウム塩の合成のための出発物質（化合物6）の合成>



スキーム1

化合物1 (S体)、化合物1に対して10当量の臭化イソプロピル、20
mol%の触媒 $\text{Bu}_4\text{N} \cdot \text{HSO}_4$ 、および10当量のフッ化カリウム2水和物を、テトラヒドロフラン中還流下で24時間反応させて、化合物2を9
5%の収率で得た。この化合物2に、テトラヒドロフラン中新たに調製した
4当量の $\text{Mg}(\text{TMP})_2$ を 0°C で滴下し、続いて -78°C で8当量の臭素
を滴下し、その後、室温で1時間攪拌して、化合物3を91%の収率で得た。
化合物3を、ジメチルホルムアミド中5mol%の酢酸パラジウム、15mol%の PPh_3 、および3当量の炭酸カリウムの存在下で、2.4当量の
3, 4, 5-トリフルオロフェニルボロン酸とのSuzuki-Miyauraの交差カップリング反応を 90°C にて8時間行って、化合物4を94%
の収率で得た。次いで、化合物4を、 0°C ～室温にてテトラヒドロフラン中
3当量の LiAlH_4 で還元し、次いで得られた化合物5を、 0°C にてテト
ラヒドロフラン中0.5当量の PBr_3 と1時間攪拌して、化合物6 (S
体)を90%の収率で得た。なお、R体についても、同様の手順により調製
した。

<実施例 1 : 4 級アンモニウム塩 (化合物 7) の合成>



アセトニトリル (5 mL) 中の化合物 6 (S 体) (280 mg, 0.4 mmol)、ジブチルアミン (140 μ L, 0.8 mmol)、および炭酸カリウム (82 mg, 0.6 mmol) の混合物を、攪拌しながら 10 時間加熱還流した。得られた混合物を水中に注ぎ、そしてジクロロメタンで抽出した。有機層抽出物を硫酸ナトリウム上で乾燥させ、そして濃縮した。残渣を、シリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶出液: メタノール/ジクロロメタン = 1 : 20) に付して精製し、化合物 7 (S 体) (247 mg, 0.33 mmol) を 83% の収率で得た。

15

得られた化合物 7 (S 体) の NMR スペクトルは以下のとおりであった:

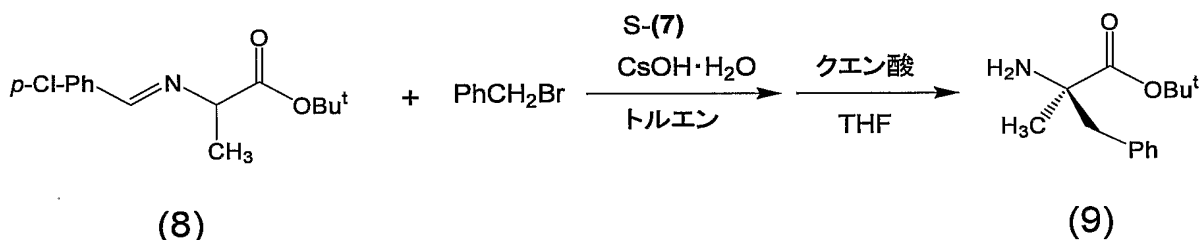
20 ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ 7.97–7.95 (4H, m, Ar–H), 7.55–7.51 (2H, m, Ar–H), 7.27–7.23 (8H, m, Ar–H), 4.99 (2H, d, $J=14.2$ Hz, Ar– CH_2), 3.74 (2H, d, $J=13.9$ Hz, Ar– CH_2), 3.32 (2H, t, $J=12.5$ Hz, N– CH_2 – CH_2), 2.56 (2H, t, $J=12.3$ Hz, N– CH_2 – CH_2), 1.06–0.97 (6H, m, CH_2), 0.71 (6H, t, $J=6.9$ Hz, CH_3), 0.23

25

(2H, bs, CH₂) ; ¹³C NMR (100MHz, CDCl₃) δ 150.95 (d, J_{C-F}=253Hz), 139.61 (ddd, J_{C-F}=253, 15, 15Hz), 138.31, 136.86, 134.64 (d, J_{C-F}=4Hz), 133.44, 131.13, 130.85, 128.31, 128.28, 127.66, 127.37, 123.34, 115.31–113.76 (m), 57.58, 57.37, 24.60, 19.32, 13.24.

化合物6のR体についても、同様の手順を行い、化合物7 (R体) を得た。

<実施例2：アラニンのα-ベンジル化の確認>

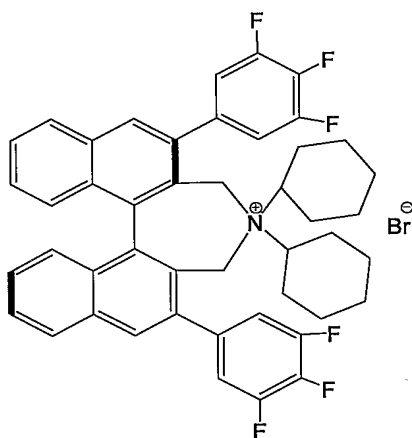


トルエン2 mL中のアラニン- (t) -ブチルエステル-p-クロロベンジルシッフ塩基 (化合物8) (134 mg, 0.5 mmol)、1モル%の化合物7 (S体)、および臭化ベンジル (1.2当量) の混合物に、水酸化セシウム・一水和物 (5当量) を0℃で加え、アルゴン雰囲気下で0℃にて3時間攪拌した。反応混合物を水に注ぎ、ジクロロメタンで抽出し、溶媒を留去して、テトラヒドロフラン5 mLに溶解した。0.5 Mクエン酸水溶液5 mLを添加し、室温にて1時間攪拌した。水層をエーテルで洗浄し、炭酸水素ナトリウムでアルカリ性とした後、ジクロロメタンで抽出した。有機層を硫酸ナトリウムで乾燥し、濃縮して、油状物を得た。得られた油状物を、シリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶出液：酢酸エチル/ヘキサン=2/1) にかけて、アラニンのベンジル化生成物 (化合物9) を82%の収率で97% ee で得た。得られた生成物の光学純度は、HPLCにて分析した

[Daicel Chiralcel AD; 溶離液: ヘキサン/イソプロパノール=30:1、0.5 mL/分; 保持時間: (R) 体=12.9分、(S) 体=20.5分]。

なお、アルゴン雰囲気下での工程を-20℃にて行ったところ、85%の
5 収率でかつ実質的に完全なエナンチオ選択性(99% ee)を有する化合物9を得ることができた。

<実施例3: 4級アンモニウム塩(化合物10)の合成>



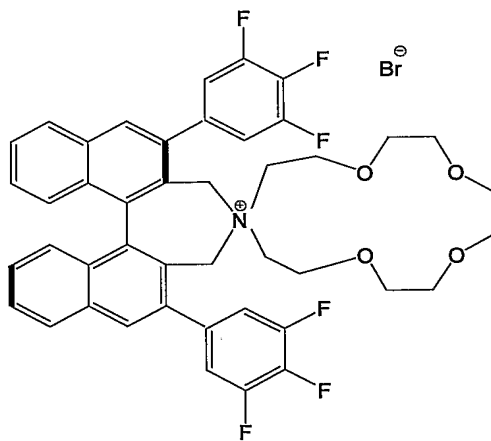
(10)

上記化合物6のR体(140 mg, 0.2 mmol)を用い、そしてジブチルアミンの代わりにジシクロヘキシルアミンを用いて、上記実施例1と同様の手順を行った。シリカゲルカラムクロマトグラフィーに付して精製し、
20 化合物10(R体)(96 mg, 0.12 mmol)を60%の収率で得た。

得られた化合物のNMRスペクトルは以下のとおりであった:¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ 8.05 (4H, bs, Ar-H), 7.65 (2H, t, J=7.7 Hz, Ar-H), 7.49 (4H, bs, Ar-H), 7.38 (2H, t, J=7.5 Hz, Ar-H), 7.27-7.24 (2H, m, Ar-H), 5.15 (2H, d, J=13.9 Hz, Ar-CH₂), 4.20 (2H, d, J=13.5 Hz, Ar-CH₂),
25

3. 18 (2H, b s, CH₂), 3. 05 (1H, b s, N-CH), 2.
 34 (2H, d, $J=9.9$ Hz, CH₂), 2. 16 (2H, d, $J=8.$
 7 Hz, CH₂), 1. 82-0. 88 (15H, m, CHおよびCH₂) ;
¹³C NMR (100MHz, CDCl₃) δ 151. 08 (d, $J_{C-F}=$
 249 Hz), 139. 56 (d, $J_{C-F}=254$ Hz), 138. 43,
 136. 76, 134. 80 (d, $J_{C-F}=3. 3$ Hz), 133. 34,
 131. 61, 131. 05, 128. 33, 127. 78, 127. 44,
 123. 58, 115. 05-114. 82 (m), 73. 95, 54. 8
 9, 53. 37, 52. 99, 30. 36, 28. 69, 28. 39, 26.
 62, 26. 45, 24. 88, 24. 76。

<実施例4：4級アンモニウム塩（化合物11）の合成>



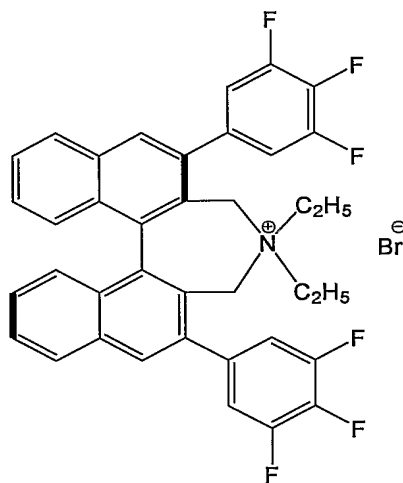
(11)

上記化合物6のR体（140mg, 0. 2mmol）を用いて、そしてジ
 ブチルアミンの代わりに1-アザ-4, 7, 10, 13-テトラオキサシク
 ロペンタデカンを用いて、上記実施例1と同様の手順を行った。シリカゲル
 カラムクロマトグラフィーに付して精製し、化合物11（59mg, 0. 0
 7mmol）を35%の収率で得た。

得られた化合物のNMRスペクトルは以下のとおりであった：¹H NM

R (400 MHz, CDCl₃) δ 8.05–8.03 (4H, m, Ar–H), 7.68–7.64 (2H, m, Ar–H), 7.43–7.35 (4H, m, Ar–H), 7.26–7.16 (4H, m, Ar–H), 4.89 (2H, d, *J*=13.9 Hz, Ar–CH₂), 4.08 (2H, bs), 4.03 (2H, d, *J*=13.5 Hz, Ar–CH₂), 3.77–3.74 (2H, m, CH₂), 3.58–3.54 (2H, m, CH₂), 3.50–3.45 (10H, m, CH₂), 3.38–3.35 (2H, m, CH₂), 3.07–3.03 (2H, m, CH₂).

10 <実施例5：4級アンモニウム塩（化合物12）の合成>



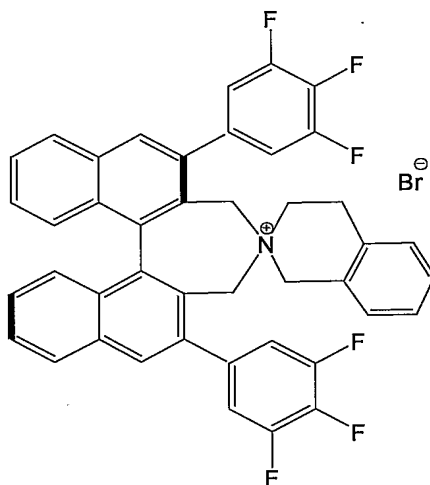
(12)

20 上記化合物6のR体（140 mg, 0.2 mmol）を用いて、そしてジブチルアミンの代わりにジエチルアミンを用いて、上記実施例1と同様の手順を行った。シリカゲルカラムクロマトグラフィーに付して精製し、化合物12（R体）（120 mg, 0.17 mmol）を87%の収率で得た。

25 得られた化合物のNMRスペクトルは以下のとおりであった：¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ 8.02 (4H, bs, Ar–H), 7.67 (2H, t, *J*=7.5 Hz, Ar–H), 7.41 (2H, t, *J*=

7. 7 Hz, Ar-H), 7. 35-7. 27 (6H, m, Ar-H), 5. 04 (2H, d, $J=13.9$ Hz, Ar-CH₂), 3. 64 (2H, d, $J=14.2$ Hz, Ar-CH₂), 3. 55-3. 47 (2H, m, N-CH₂-CH₃), 2. 73 (2H, q, $J=6.9$ Hz, N-CH₂-CH₃), 0. 64 (6H, t, $J=6.9$ Hz, CH₃)。

<実施例6：4級アンモニウム塩（化合物13）の合成>



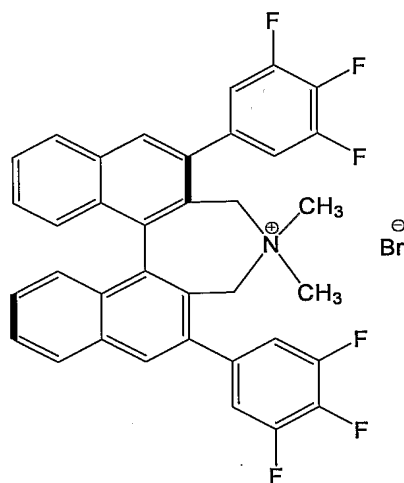
(13)

上記化合物6のR体（140mg, 0. 2mmol）を用いて、そしてジブチルアミンの代わりに1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリンを用いて、上記実施例1と同様の手順を行った。シリカゲルカラムクロマトグラフィーに付して精製し、化合物13（117mg, 0. 16mmol）を78%の収率で得た。

得られた化合物のNMRスペクトルは以下のとおりであった：¹H NMR（400MHz, CDCl₃）δ 8. 08-8. 02（4H, m, Ar-H）, 7. 71-7. 63（2H, m, Ar-H）, 7. 47-7. 35（4H, m, Ar-H）, 7. 26-7. 14（3H, m, Ar-H）, 7. 07（2H, dd, $J=7.5, 7.5$ Hz, Ar-H）, 6. 99（2H,

d, $J=7.5\text{ Hz}$, Ar-H), 6.63 (1H, d, $J=7.5\text{ Hz}$, Ar-H), 5.45 (1H, d, $J=15.0\text{ Hz}$, N-CH₂), 5.42 (1H, d, $J=13.9\text{ Hz}$, N-CH₂), 4.83 (1H, d, $J=12.7\text{ Hz}$, N-CH₂), 4.12 (1H, d, $J=13.9\text{ Hz}$, N-CH₂), 3.94-3.86 (2H, m, N-CH₂), 3.66 (1H, dd, $J=11.7, 6.1\text{ Hz}$), 3.36 (1H, dt, $J=12.4, 5.3\text{ Hz}$), 3.15-3.06 (1H, m), 2.83 (1H, dd, $J=18.2, 4.7\text{ Hz}$, CH₃)。

<実施例7：4級アンモニウム塩（化合物14）の合成>



(14)

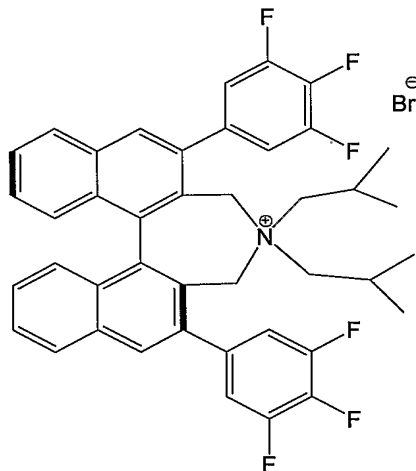
上記化合物6のS体（140mg, 0.2mmol）を用いて、そしてジブチルアミンの代わりにジメチルアミンを用いて、上記実施例1と同様の手順を行った。シリカゲルカラムクロマトグラフィーに付して精製し、化合物14（117mg, 0.18mmol）を88%の収率で得た。

得られた化合物のNMRスペクトルは以下のとおりであった：¹H NMR（400MHz, CDCl₃） δ 8.03-8.01（4H, m, Ar-H），7.64（2H, t, $J=7.3\text{ Hz}$, Ar-H），7.41-7.

3.5 (4H, m, Ar-H), 7.12 (4H, bs, Ar-H), 4.92 (2H, d, $J=13.5$ Hz, Ar-CH₂), 3.76 (2H, d, $J=13.9$ Hz, Ar-CH₂), 2.96 (6H, s, N-CH₃)。

5 <実施例8：4級アンモニウム塩（化合物15）の合成>

10



(15)

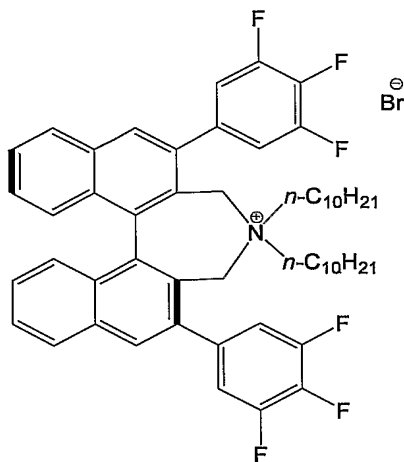
15 上記化合物6のS体（140mg, 0.2mmol）を用いて、そしてジブチルアミンの代わりにジイソブチルアミンを用いて、上記実施例1と同様の手順を行った。シリカゲルカラムクロマトグラフィーに付して精製し、化合物15（137mg, 0.18mmol）を91%の収率で得た。

20 得られた化合物のNMRスペクトルは以下のとおりであった：¹H NMR（400MHz, CDCl₃） δ 8.00–7.96（4H, m, Ar-H）, 7.58–7.54（2H, m, Ar-H）, 7.34–7.21（8H, m, Ar-H）, 4.54（2H, d, $J=13.1$ Hz, Ar-CH₂）, 4.11（2H, d, $J=13.4$ Hz, Ar-CH₂）, 3.08（2H, dd, $J=13.3, 4.9$ Hz, N-CH₂-CH）, 2.39（2H, dd, $J=13.4, 4.9$ Hz, N-CH₂-CH）, 2.00–1.93（2H, m, CH）, 0.86（2H, d, $J=6.3$ Hz,

25

CH₃) , 0.76 (2H, d, $J=6.7$ Hz, CH₃) 。

<実施例9：4級アンモニウム塩（化合物16）の合成>

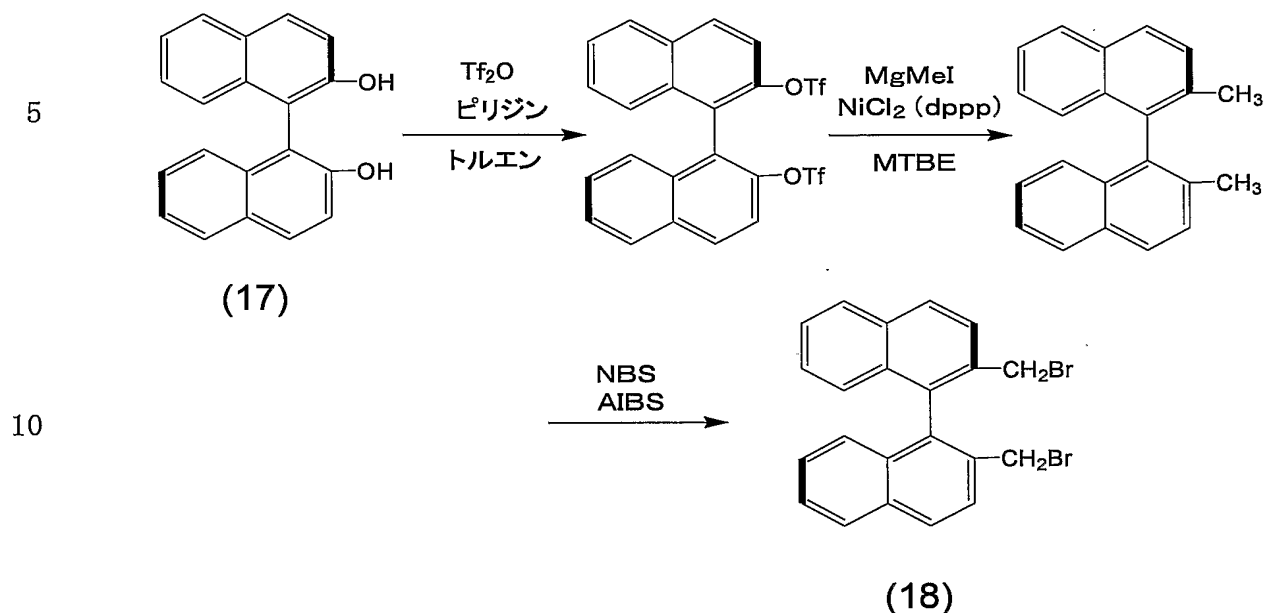


(16)

上記化合物6のS体（140mg, 0.2mmol）を用いて、そしてジブチルアミンの代わりにジ-n-デシルアミンを用いて、上記実施例1と同様の手順を行った。シリカゲルカラムクロマトグラフィーに付して精製し、化合物16（117mg, 0.13mmol）を64%の収率で得た。

得られた化合物のNMRスペクトルは以下のとおりであった：¹H NMR（400MHz, CDCl₃） δ 7.98–7.97（4H, m, Ar–H）, 7.57–7.53（2H, m, Ar–H）, 7.32–7.27（8H, m, Ar–H）, 4.96（2H, d, $J=13.9$ Hz, Ar–CH₂）, 3.76（2H, d, $J=14.2$ Hz, Ar–CH₂）, 3.22（2H, t, $J=12.7$ Hz, Ar–CH₂）, 2.78（1H, t, $J=8.1$ Hz, Ar–CH₂）, 2.60（2H, t, $J=11.1$ Hz, CH₂）, 1.80（1H, bs）, 1.29–0.85（34H, m）, 0.34（2H, m）。

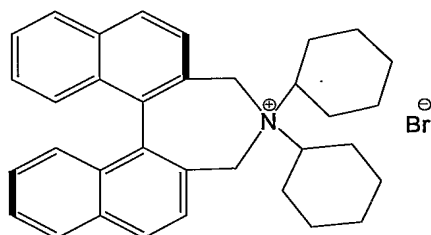
＜参考例 2：4 級アンモニウム塩の合成のための出発物質（化合物 18）の合成＞



化合物 17（R 体）と化合物 17 に対して 4 当量のピリジンとの混合物に、
 15 トルエン中 3 当量のトリフルオロメタンスルホン酸無水物（ Tf_2O ）を、
 40 分かけて窒素雰囲気中で $2 \sim 9^\circ\text{C}$ にて攪拌しながら滴下した。滴下終了
 後、得られた混合物を室温にて 3 時間攪拌した。この混合物に、ピリジン、
 水、および 35% 塩酸を加えた後、有機層を回収し、トリフルル化物を定量
 的に得た。次いで、tert-ブチルメチルエステル（MTBE）中で、M
 20 eI（3 当量）を Mg（3 当量）溶液に滴下し、これに $\text{NiCl}_2(\text{dppp})$ （0.05 当量）を加え、さらに上記のトリフルル化物を滴下して、 55°C にて加熱還流下で 30 分間攪拌した。得られた混合物にトルエンを加え、
 冷水中に注ぎ、塩酸を加えた後、有機層を回収し、ジメチル化物を 96.
 1% の収率で得た。次いで、ジメチル化物に、シクロヘキサン中、N-ブロ
 25 モスクシンイミド（NBS；2.5 当量）および 2,2'-アゾビスイソブ
 チロニトリル（AIBN；0.05 当量）を室温にて加え、攪拌しながら 2

時間加熱還流した。混合物を室温まで冷却した後、酢酸エチルを加えて攪拌し、水中に注いだ。2層混合物を、沈殿が生じなくなるまで攪拌し、沈殿物を回収し、化合物18（R体）を54.3%の収率で得た。

5 <実施例10：4級アンモニウム塩（化合物19）の合成>



(19)

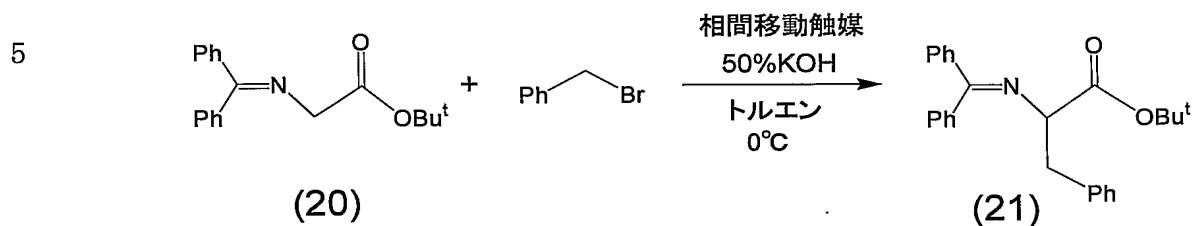
10 上記化合物18（R体）（88mg，0.2mmol）を用いて、そしてジブチルアミンの代わりにジシクロヘキシルアミンを用いて、上記実施例1と同様の手順を行った。シリカゲルカラムクロマトグラフィーに付して精製し、化合物19（54mg，0.10mmol）を50%の収率で得た。

20 得られた化合物のNMRスペクトルは以下のとおりであった：¹H NMR（400MHz，CDCl₃）δ 8.12（2H，d，*J*=8.3Hz，Ar-H），8.02（2H，d，*J*=8.7Hz，Ar-H），7.90（2H，d，*J*=8.3Hz，Ar-H），7.59（2H，dd，*J*=7.6，8.3Hz，Ar-H），7.42（2H，d，*J*=8.7Hz，Ar-H），7.36（2H，dd，*J*=7.6，8.3Hz，Ar-H），5.40（2H，d，*J*=12.7Hz，Ar-CH₂），3.61（2H，d，*J*=13.5Hz，Ar-CH₂），3.36（2H，t，*J*=11.9Hz，CH₂），3.17（2H，bs，CH₂），3.03（2H，d，*J*=10.3Hz，CH₂），2.47（2H，d，*J*=11.1Hz，CH₂），

25

2. 25-1.07 (14H, m)。

<実施例 11：種々の相間移動触媒による α -ベンジル化反応>



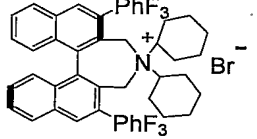
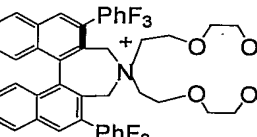
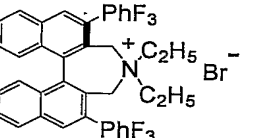
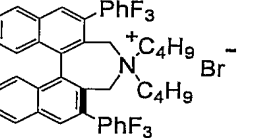
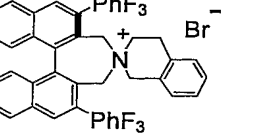
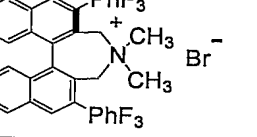
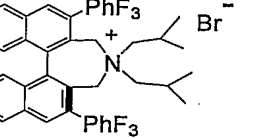
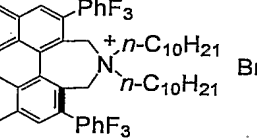
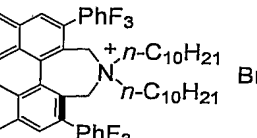
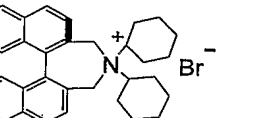
グリシンtert-ブチルエステルベンゾフェノンシッフ塩基（化合物 20）（14.8mg, 0.5mmol）、化合物 20 に対して以下の表 1 に記載の量の相間移動触媒、50%水酸化カリウム水溶液（1.0mL）、およびトルエン（3.0mL）を混合して、臭化ベンジル（72.8 μ g, 0.5mmol）を 0℃にて滴下した。0℃にてそれぞれ以下の表 1 に記載の時間攪拌した後、反応混合物を水に注ぎ、エーテルで抽出した。エーテル抽出物を飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥して、減圧濃縮した。油状残渣を、シリカゲルカラムクロマトグラフィー（エーテル／ヘキサン＝1／10で溶出）に付し、（S）-フェニルアラニンtert-ブチルエステルベンゾフェノンシッフ塩基（化合物 21）を得た。得られた生成物の光学純度は、HPLCにて分析した [Daicel Chiralcel OD；溶離液：ヘキサン／2-プロパノール＝100：1、0.5mL／分；保持時間：（R）体＝14.8分、（S）体＝28.2分]。

10

15

20

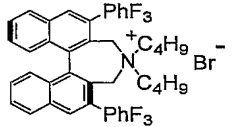
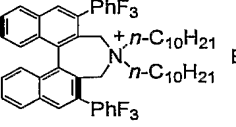
表 1

相間移動触媒(使用量)	反応時間(時間)	収率(%)	光学純度(%ee)
 化合物10 (1mol%)	48	14	5
 化合物11 (1mol%)	20	94	87
 化合物12 (1mol%)	48	14	89
 化合物7 (3mol%)	21	86	97
 化合物13 (1mol%)	32	80	85
 化合物14 (3mol%)	54	63	14
 化合物15 (3mol%)	36	80	1
 化合物16 (1mol%)	48	20	98
 化合物16 (3mol%)	48	18	97
 化合物19 (3mol%)	7日	11	6

<実施例 12 : α -ベンジル化反応の温度の影響の検討>

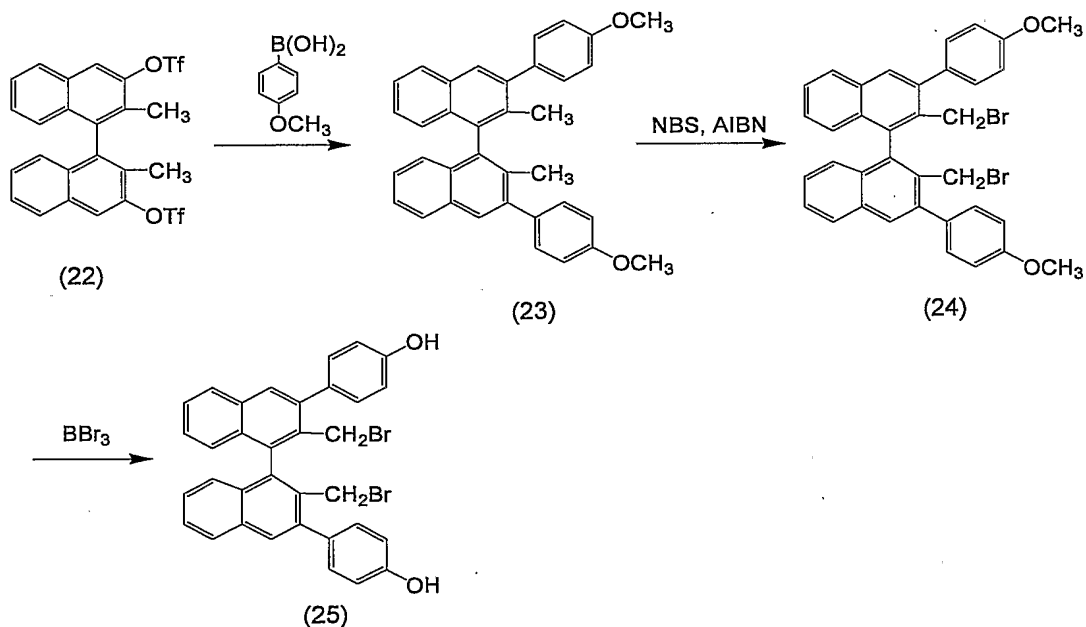
上記実施例 11 に準じて、相間移動触媒（化合物 7（R）または化合物 16（S））を 3 mol % 用いて 0℃または室温にて α -ベンジル化を行った。結果を表 2 に示す。

表 2

相間移動触媒	反応温度	反応時間 (時間)	収率 (%)	光学純度 (%ee)
 化合物 7	0℃	21	86	97
	室温	3	95	71
 化合物 16	0℃	48	18	97
	室温	1	91	92

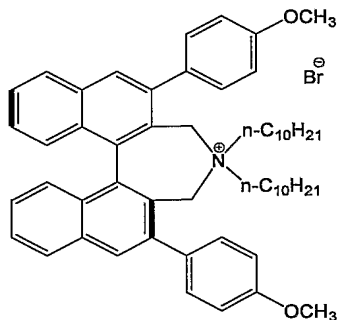
温度が高い場合は反応時間が短く収率もよいが、光学純度については低温の場合が良好な傾向が見られた。

<参考例 3 : 4 級アンモニウム塩の合成のための出発物質（化合物 24 および化合物 25）の合成>



化合物 22 (S 体) と、化合物 22 (S 体) に対して 2 当量の 4-メトキシフェニルボロン酸との S u z u k i のカップリング反応を行って、化合物 23 を良好な収率で得た。化合物 23 を、ベンゼン中 2.2 当量の N-ブロモスクシンイミド (NBS) および 0.1 当量の 2,2'-アゾビスイソブチロニトリル (AIBN) と加熱還流して、化合物 24 を良好な収率で得た。次いで、化合物 24 を、2.4 当量の BBr₃ で処理して、化合物 25 を良好な収率で得た。なお、R 体についても、同様の手順により調製できる。

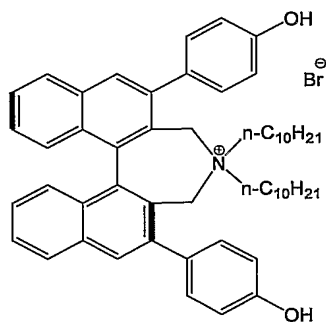
<実施例 13 : 4 級アンモニウム塩 (化合物 26) の合成>



(26)

上記化合物 24 (S 体) を用いて、そしてジブチルアミンの代わりにジ n-デシルアミンを用いて、上記実施例 1 と同様の手順を行った。シリカゲルカラムクロマトグラフィーに付して精製し、化合物 26 を良好な収率で得た。

<実施例 14 : 4 級アンモニウム塩 (化合物 27) の合成>



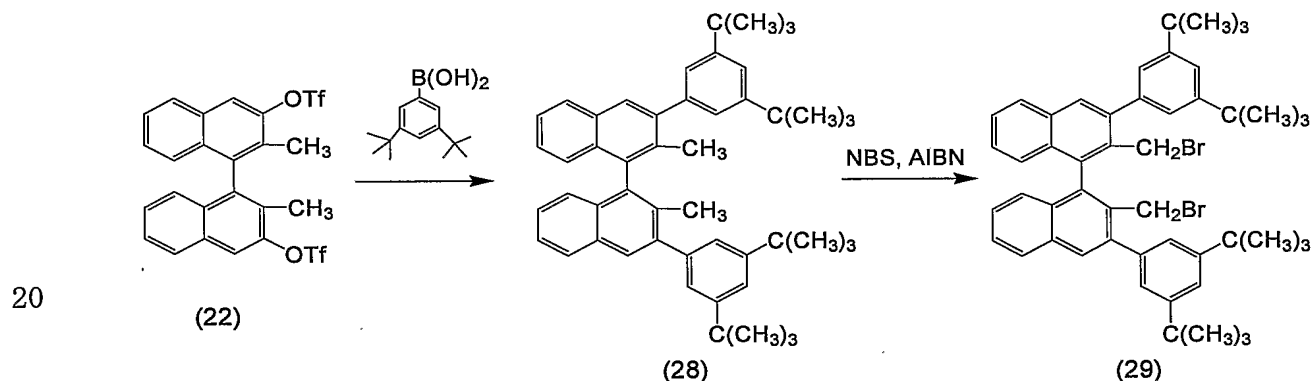
(27)

上記化合物 25 (S 体) を用いて、そしてジブチルアミンの代わりにジ
 n-デシルアミンを用いて、上記実施例 1 と同様の手順を行った。シリカゲ
 ルカラムクロマトグラフィーに付して精製し、化合物 27 を良好な収率で得
 た。

5 得られた化合物の NMR スペクトルは以下のとおりであった：¹H NM
 R (400 MHz, CDCl₃) δ 8.04 (2H, s, Ar-H), 7.
 99 (2H, d, J=8.3 Hz, Ar-H), 7.62-7.59 (2H,
 m, Ar-H), 7.37-7.22 (12H, m, Ar-H), 4.92
 (2H, d, J=13.1 Hz, Ar-CH₂), 3.43 (2H, d, J
 10 =13.1 Hz, Ar-CH₂), 3.17 (2H, brs, -CH₂-),
 2.74-2.68 (2H, m, -CH₂-), 1.25-0.82 (36
 H, m, -CH₂-, -CH₃), 0.34 (2H, brs, -CH₂-)。

<参考例 4：4 級アンモニウム塩の合成のための出発物質 (化合物 29)

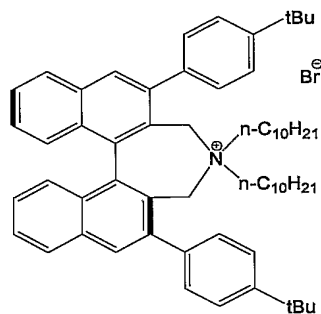
15 の合成>



化合物 22 (S 体) と、化合物 22 に対して 2 当量の 3, 5-ジ-*tert*-
 ブチルフェニルボロン酸との Suzuki のカップリング反応を、水お
 25 よびジメチルエーテル中、化合物 22 に対して 3 当量の水酸化バリウム 8 水
 和物、5 mol % の酢酸パラジウム、および 1.2 mol % のトリフェニル

ホスフィン中で7時間還流して行った。室温まで冷却した後、塩化アンモニウム飽和液を加え、エチルエーテルで抽出して、化合物28を88%の収率で得た。次いで、化合物28を、ベンゼン中2当量のNBSおよび0.1当量のAIBNを1時間還流し、濃縮した後、シリカゲルカラムクロマトグラフィーにかけて、化合物29を77%の収率で得た。なお、R体についても、同様の手順により調製できる。

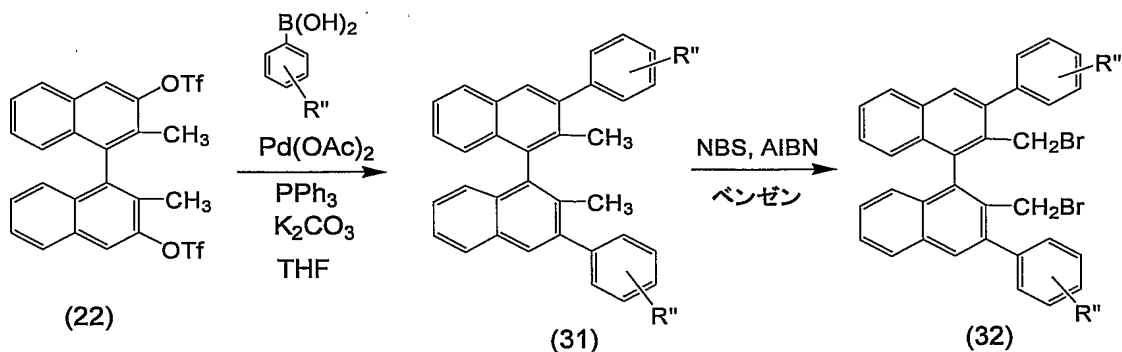
<実施例15：4級アンモニウム塩（化合物30）の合成>



(30)

上記化合物29（S体）を用いて、そしてジブチルアミンの代わりにジ-n-デシルアミンを用いて、上記実施例1と同様の手順を行った。シリカゲルカラムクロマトグラフィーに付して精製し、化合物30を良好な収率で得た。

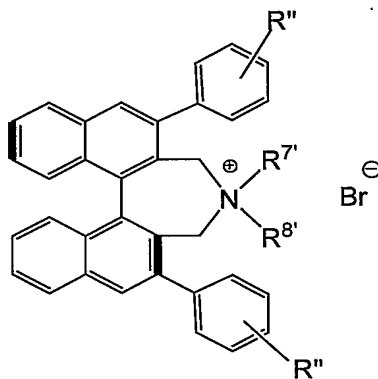
<参考例5：4級アンモニウム塩の合成のための出発物質（化合物32）の合成（1）>



(ここで、R'' は、p-フルオロ、m-フルオロ、3,4-ジフルオロ、3,4,5-トリフルオロ、p-クロロ、m-クロロ、3,4,5-トリクロロ、3,5-トリフルオロメチル、3,5-ジ-tert-ブチル、p-メトキシ、p-トリフルオロメトキシ、p-ヒドロキシ、3,5-ジフェニル、p-(3,4,5-トリフルオロフェニル)、p-(2,3,4,5,6-ペンタフルオロフェニル)、m-シアノ、またはm-ニトロであり、2つのR'' は同一であっても異なってもよい)。

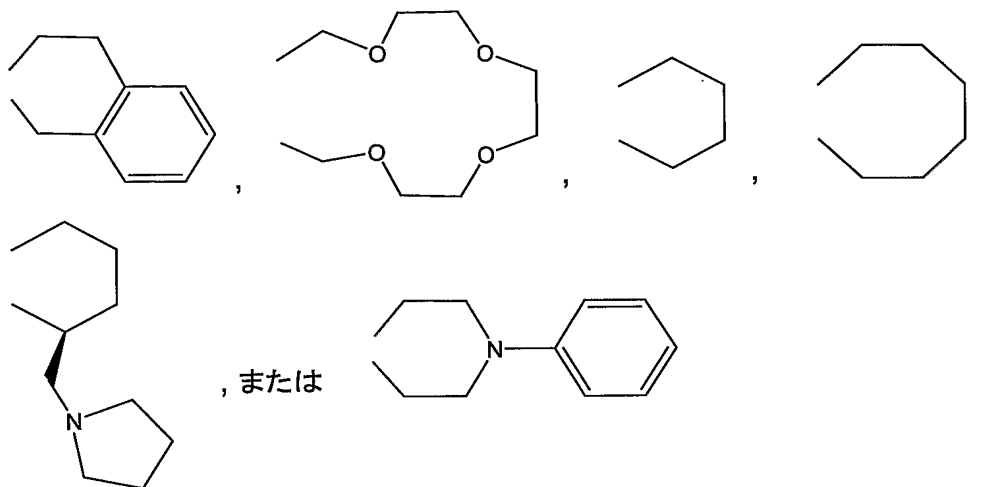
化合物22 (S体) と、化合物22に対して2当量のアリールボロン酸誘導体とのSuzukiのカップリング反応を、テトラヒドロフラン中、3当量の水酸化カリウムまたはリン酸カリウム、5mol%の酢酸パラジウム、および1.2mol%のトリフェニルホスフィン中で7時間還流して行った。室温まで冷却した後、塩化アンモニウム飽和液を加え、エチルエーテルで抽出して、化合物31を87%の収率で得た。次いで、化合物31を、ベンゼン中2当量のN-ブロモスクシンイミドおよび0.1当量の2,2'-アゾビスイソブチロニトリルを1時間還流し、濃縮した後、シリカゲルカラムクロマトグラフィーにかけて、化合物32を97%の収率で得た。なお、R体についても、同様の手順により調製できる。

<実施例16：4級アンモニウム塩（化合物33）の合成（1）>



(33)

上記化合物 3 2 (S 体) を用いて、上記実施例 1 のジブチルアミン、あるいは実施例 1 のジブチルアミンの代わりにジアミン R^7-NH-R^8 (ここで、 R^7 および R^8 は、同一であって、メチル、*n*-ブチル、イソブチル、1-ヒドロキシエチル、1-メトキシエチル、*n*-デシル、シクロヘキシル、または 1-プロピニルであるか、あるいは R^7 および R^8 が一緒になって、



15 である) を用いて、上記実施例 1 と同様の手順を行った。シリカゲルカラムクロマトグラフィーに付して精製し、それぞれ良好な収率で化合物 3 3 を得た。なお、R 体についても、同様の手順により調製できる。

得られた具体的な化合物について、その構造式および NMR スペクトルデータを表 3 ~ 7 に示す。

表 3

5		^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ 8.05 (2H, s, Ar-H), 8.02 (2H, d, $J = 8.3$ Hz, Ar-H), 7.63 (2H, dd, $J = 7.3, 7.3$ Hz, Ar-H), 7.58 (4H, brs, Ar-H), 7.40–7.29 (8H, m, Ar-H), 5.09 (2H, d, $J = 13.7$ Hz, Ar- CH_2), 3.66 (2H, d, $J = 13.7$ Hz, Ar- CH_2), 3.21 (2H, t, $J = 12.9$ Hz, N- CH_2 - CH_2 -), 2.55 (2H, dt, $J = 4.0, 12.9$ Hz, N- CH_2 - CH_2 -), 1.01–0.98 (4H, m, $-\text{CH}_2$ -), 0.92–0.85 (2H, m, $-\text{CH}_2$ -), 0.67 (6H, t, $J = 6.9$ Hz, $-\text{CH}_3$), 0.23–0.20 (2H, m, $-\text{CH}_2$ -)
10		^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ 8.03 (2H, s, Ar-H), 8.00 (2H, d, $J = 7.9$ Hz, Ar-H), 7.61 (2H, dd, $J = 6.7, 6.7$ Hz, Ar-H), 7.54 (8H, brs, Ar-H), 7.37–7.29 (4H, m, Ar-H), 5.03 (2H, d, $J = 13.9$ Hz, Ar- CH_2), 3.64 (2H, d, $J = 13.9$ Hz, Ar- CH_2), 3.14 (2H, t, $J = 13.0$ Hz, N- CH_2 - CH_2 -), 2.52 (2H, dt, $J = 4.4, 13.0$ Hz, N- CH_2 - CH_2 -), 0.98–0.96 (4H, m, $-\text{CH}_2$ -), 0.84–0.82 (2H, m, $-\text{CH}_2$ -), 0.65 (6H, t, $J = 6.9$ Hz, $-\text{CH}_3$), 0.20–0.15 (2H, m, $-\text{CH}_2$ -)
15		^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ 8.02 (2H, s, Ar-H), 7.98 (2H, d, $J = 8.3$ Hz, Ar-H), 7.60–7.57 (4H, m, Ar-H), 7.35–7.28 (8H, m, Ar-H), 7.12 (2H, dd, $J = 8.3$ Hz, Ar-H), 5.03 (2H, br, N- CH_2 -), 3.61 (2H, d, $J = 12.7$ Hz, N- CH_2 -), 3.15 (2H, br, N- CH_2 -), 2.51 (2H, brs, N- CH_2 -), 0.95–0.89 (6H, m, $-\text{CH}_2$ -), 0.61 (6H, t, $J = 6.1$ Hz, $-\text{CH}_3$), 0.13 (2H, brs, $-\text{CH}_2$ -)
20		^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ 8.03(2H, s, Ar-H), 8.00 (2H, d, $J = 7.9$ Hz, Ar-H), 7.61 (2H, dd, $J = 7.3$ Hz, Ar-H), 7.56 (4H, brs, Ar-H), 7.43 (2H, d, $J = 7.5$ Hz, Ar-H), 7.37–7.29 (6H, m, Ar-H), 5.05 (2H, brs, N- CH_2), 3.60 (2H, brs, N- CH_2), 3.19 (2H, brs, N- CH_2 -), 2.51 (2H, brs, N- CH_2 -), 0.97–0.84 (6H, m, $-\text{CH}_2$ -), 0.65 (6H, t, $J = 6.7$ Hz, $-\text{CH}_3$), 0.15 (2H, brs, $-\text{CH}_2$ -)
25		

表 4

5		¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 8.05 (2H, s, Ar-H), 8.05 (2H, d, <i>J</i> = 8.0 Hz, Ar-H), 7.73–7.63 (6H, m, Ar-H), 7.42 (2H, dd, <i>J</i> = 8.3, 8.3 Hz, Ar-H), 7.33 (2H, d, <i>J</i> = 8.3 Hz, Ar-H), 4.99 (2H, d, <i>J</i> = 13.9 Hz, Ar-CH ₂), 3.78 (2H, d, <i>J</i> = 13.9 Hz, Ar-CH ₂), 3.34 (2H, t, <i>J</i> = 13.5 Hz, N-CH ₂ -CH ₂ -), 2.67 (2H, dt, <i>J</i> = 4.7, 13.1 Hz, N-CH ₂ -CH ₂ -), 1.13–1.11 (4H, m, -CH ₂ -), 1.03–0.99 (2H, m, -CH ₂ -), 0.73 (6H, t, <i>J</i> = 7.5 Hz, -CH ₃), 0.39–0.35 (2H, m, -CH ₂ -)
10		¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 8.06 (2H, s, Ar-H), 8.03 (2H, d, <i>J</i> = 7.9 Hz, Ar-H), 7.66–7.62 (6H, m, Ar-H), 7.45–7.32 (8H, m, Ar-H), 5.07 (2H, d, <i>J</i> = 13.9 Hz, Ar-CH ₂), 3.70 (2H, d, <i>J</i> = 13.9 Hz, Ar-CH ₂), 3.20 (2H, t, <i>J</i> = 12.5 Hz, N-CH ₂ -CH ₂ -), 2.57 (2H, t, <i>J</i> = 12.9 Hz, N-CH ₂ -CH ₂ -), 0.98–0.95 (4H, m, -CH ₂ -), 0.90–0.87 (2H, m, -CH ₂ -), 0.65 (6H, t, <i>J</i> = 6.9 Hz, -CH ₃), 0.25–0.21 (2H, m, -CH ₂ -)
15		¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 8.21 (2H, s, Ar-H), 8.08 (2H, d, <i>J</i> = 8.3 Hz, Ar-H), 7.99 (2H, s, Ar-H), 7.94 (2H, s, Ar-H), 7.82–7.78 (8H, m, Ar-H), 7.69–7.62 (4H, m, Ar-H), 7.53–7.33 (16H, m, Ar-H), 5.15 (2H, d, <i>J</i> = 13.7 Hz, Ar-CH ₂), 3.87 (2H, d, <i>J</i> = 13.7 Hz, Ar-CH ₂), 3.24 (2H, t, <i>J</i> = 12.5 Hz, N-CH ₂ -CH ₂ -), 2.77 (2H, dt, <i>J</i> = 4.4, 12.7 Hz, N-CH ₂ -CH ₂ -), 1.00–0.95 (4H, m, -CH ₂ -), 0.82–0.78 (2H, m, -CH ₂ -), 0.47–0.44 (8H, m, -CH ₂ -, -CH ₃)
20		¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃ , 65°C) δ 8.07–7.99 (6H, m, Ar-H), 7.82–7.77 (6H, m, Ar-H), 7.67 (2H, dd, <i>J</i> = 7.7, 7.7 Hz, Ar-H), 7.41 (2H, dd, <i>J</i> = 7.7, 7.7 Hz, Ar-H), 7.33 (2H, d, <i>J</i> = 7.9 Hz, Ar-H), 5.01 (2H, brs, N-CH ₂), 3.76–3.74 (2H, m, N-CH ₂ -), 3.31 (2H, br, N-CH ₂), 2.56 (2H, brs, N-CH ₂ -), 1.05 (4H, brs, -CH ₂ -), 0.93–0.92 (2H, m, -CH ₂ -), 0.69 (6H, t, <i>J</i> = 7.1 Hz, -CH ₃), 0.24 (2H, brs, -CH ₂ -)
25		

表 5

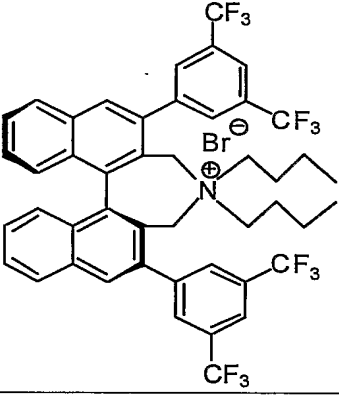
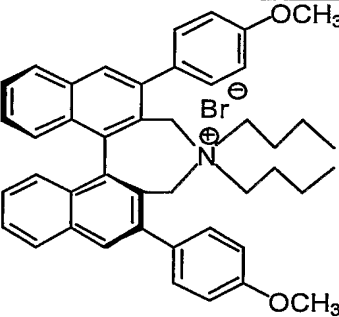
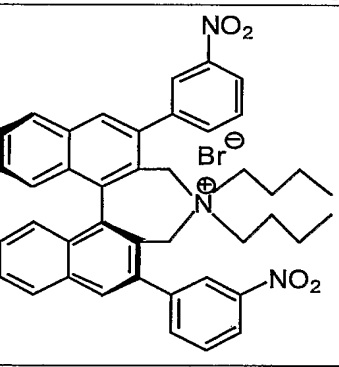
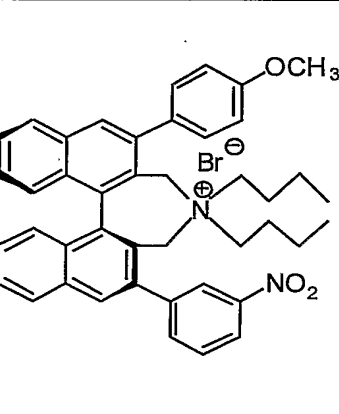
	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 8.22 (2H, brs, Ar-H), 8.10–8.05 (8H, m, Ar-H), 7.73–7.69 (2H, m, Ar-H), 7.48–7.44 (2H, m, Ar-H), 7.40–7.38 (2H, m, Ar-H), 4.83 (2H, d, <i>J</i> = 14.3 Hz, Ar-CH ₂), 4.03 (2H, d, <i>J</i> = 14.3 Hz, Ar-CH ₂), 3.37 (2H, t, <i>J</i> = 13.1 Hz, N-CH ₂ -CH ₂ -), 2.65 (2H, t, <i>J</i> = 12.9 Hz, N-CH ₂ -CH ₂ -), 1.10 (4H, brs, -CH ₂ -), 0.87 (2H, brs, -CH ₂ -), 0.63 (6H, t, <i>J</i> = 6.7 Hz, -CH ₃), 0.32 (2H, brs, -CH ₂ -)
	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 8.01 (2H, s, Ar-H), 7.97 (2H, d, <i>J</i> = 7.9 Hz, Ar-H), 7.60–7.56 (2H, m, Ar-H), 7.46 (4H, brs, Ar-H), 7.32–7.31 (4H, m, Ar-H), 7.08 (4H, d, <i>J</i> = 8.0 Hz, Ar-H), 5.05 (2H, d, <i>J</i> = 13.5 Hz, Ar-CH ₂), 3.84 (6H, s, -OCH ₃), 3.57 (2H, d, <i>J</i> = 13.5 Hz, Ar-CH ₂), 3.03 (2H, t, <i>J</i> = 13.1 Hz, N-CH ₂ -CH ₂ -), 2.52 (2H, dt, <i>J</i> = 4.0, 12.3 Hz, N-CH ₂ -CH ₂ -), 0.94–0.87 (6H, m, -CH ₂ -), 0.62 (6H, t, <i>J</i> = 6.9 Hz, -CH ₃), 0.21–0.17 (2H, brs, -CH ₂ -)
	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃ , 65°C) δ 8.34 (2H, s, Ar-H), 8.33 (2H, d, <i>J</i> = 7.9 Hz, Ar-H), 8.12 (2H, s, Ar-H), 8.10–8.06 (4H, m, Ar-H), 7.90 (2H, dd, <i>J</i> = 7.7, 7.7 Hz, Ar-H), 7.68 (2H, dd, <i>J</i> = 7.1, 7.1 Hz, Ar-H), 7.43 (2H, dd, <i>J</i> = 7.3, 7.3 Hz, Ar-H), 7.36 (2H, d, <i>J</i> = 8.7 Hz, Ar-H), 5.05 (2H, brs, N-CH ₂ -), 3.78 (2H, d, <i>J</i> = 13.1 Hz, N-CH ₂ -), 3.35 (2H, brs, N-CH ₂ -), 2.56 (2H, t, <i>J</i> = 12.7 Hz, N-CH ₂ -), 1.01–0.99 (4H, m, -CH ₂ -), 0.82–0.80 (2H, m, -CH ₂ -), 0.58 (6H, t, <i>J</i> = 7.5 Hz, -CH ₃), 0.22 (2H, brs, -CH ₂ -)
	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃ , 65°C) δ 8.37 (1H, s, Ar-H), 8.32 (1H, d, <i>J</i> = 8.3 Hz, Ar-H), 8.24 (1H, d, <i>J</i> = 7.5 Hz, Ar-H), 8.12 (1H, s, Ar-H), 8.08–7.96 (4H, m, Ar-H), 7.68–7.61 (2H, m, Ar-H), 7.43–7.30 (6H, m, Ar-H), 7.09 (2H, d, <i>J</i> = 7.9 Hz, Ar-H), 5.26 (1H, brs, N-CH ₂ -), 4.96 (1H, d, <i>J</i> = 12.3 Hz, N-CH ₂ -), 3.88 (3H, s, -OCH ₃), 3.78 (1H, d, <i>J</i> = 13.9 Hz, N-CH ₂ -), 3.59 (2H, d, <i>J</i> = 12.3 Hz, N-CH ₂ -), 2.82–2.78 (1H, m, N-CH ₂ -), 2.57 (2H, brs, N-CH ₂ -), 1.08 (2H, brs, -CH ₂ -), 0.93 (4H, brs, -CH ₂ -), 0.66 (3H, t, <i>J</i> = 6.1 Hz, -CH ₃), 0.58 (3H, t, <i>J</i> = 7.2 Hz, -CH ₃), 0.32–0.24 (2H, m, -CH ₂ -)

表 6

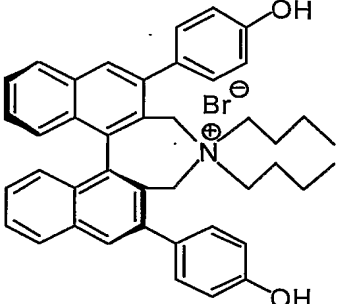
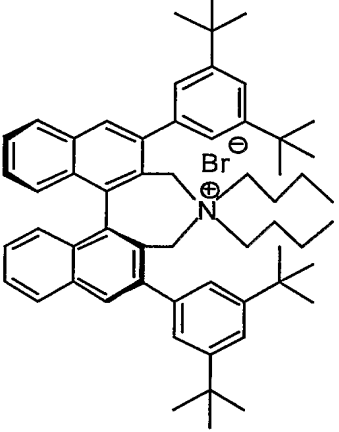
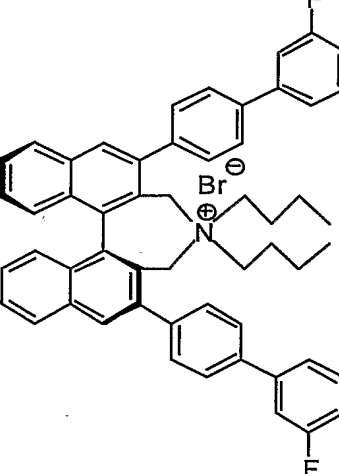
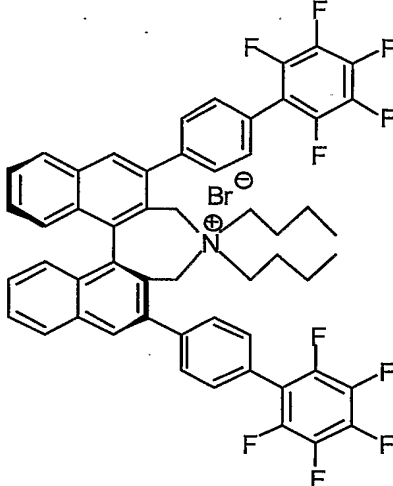
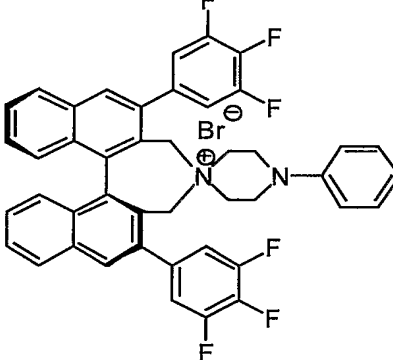
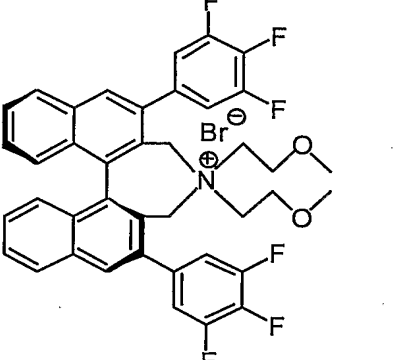
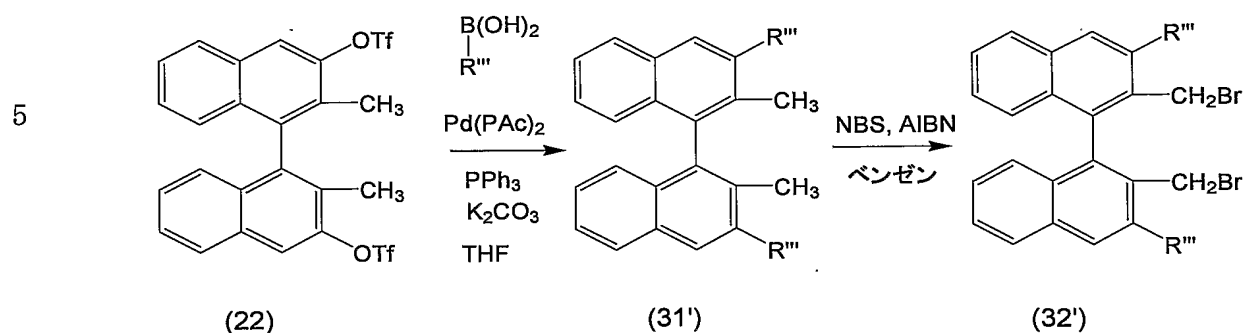
<p>5</p> 	<p>^1H NMR (400 MHz, CD_3OD) δ 8.12 (2H, s, Ar-H), 8.09 (2H, d, $J = 8.3$ Hz, Ar-H), 7.64–7.60 (2H, m, Ar-H), 7.51–7.22 (8H, m, Ar-H), 6.96 (4H, brs, Ar-H), 4.86 (2H, d, $J = 13.5$ Hz, Ar-CH_2), 3.58 (2H, d, $J = 13.5$ Hz, Ar-CH_2), 2.74 (2H, t, $J = 12.7$ Hz, N-CH_2-CH_2-), 2.55 (2H, brs, N-CH_2-CH_2-), 1.00–0.95 (6H, m, $-\text{CH}_2$-), 0.71 (6H, t, $J = 6.3$ Hz, $-\text{CH}_3$), 0.23 (2H, brs, $-\text{CH}_2$-)</p>
<p>10</p> 	<p>^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ 8.09 (2H, s, Ar-H), 8.06 (2H, d, $J = 8.3$ Hz, Ar-H), 7.66–7.62 (2H, m, Ar-H), 7.57 (2H, s, Ar-H), 7.47 (2H, s, Ar-H), 7.42–7.37 (4H, m, Ar-H), 7.21 (2H, s, Ar-H), 5.09 (2H, d, $J = 13.5$ Hz, Ar-CH_2), 3.79 (2H, d, $J = 13.5$ Hz, Ar-CH_2), 3.16 (2H, t, $J = 13.1$ Hz, N-CH_2-CH_2-), 2.52 (2H, t, $J = 6.0, 13.3$ Hz, N-CH_2-CH_2-), 1.42 (18H, s, $-\text{CH}_3$), 1.37 (18H, s, $-\text{CH}_3$), 1.05–1.02 (4H, brs, $-\text{CH}_2$-), 0.84–0.82 (2H, brs, $-\text{CH}_2$-), 0.62 (6H, t, $J = 6.9$ Hz, $-\text{CH}_3$), 0.53–0.49 (2H, brs, $-\text{CH}_2$-)</p>
<p>20</p> 	<p>^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ 8.12 (2H, s, Ar-H), 8.05 (2H, d, $J = 8.3$ Hz, Ar-H), 7.74–7.64 (10H, m, Ar-H), 7.42–7.36 (4H, m, Ar-H), 7.30–7.26 (4H, m, Ar-H), 5.20 (2H, d, $J = 13.7$ Hz, Ar-CH_2), 3.68 (2H, d, $J = 13.7$ Hz, Ar-CH_2), 3.26 (2H, t, $J = 12.7$ Hz, N-CH_2-CH_2-), 2.56 (2H, dt, $J = 4.0, 12.7$ Hz, N-CH_2-CH_2-), 0.98–0.96 (4H, m, $-\text{CH}_2$-), 0.87–0.82 (2H, m, $-\text{CH}_2$-), 0.53 (6H, t, $J = 6.9$ Hz, $-\text{CH}_3$), 0.26–0.23 (2H, m, $-\text{CH}_2$-)</p>

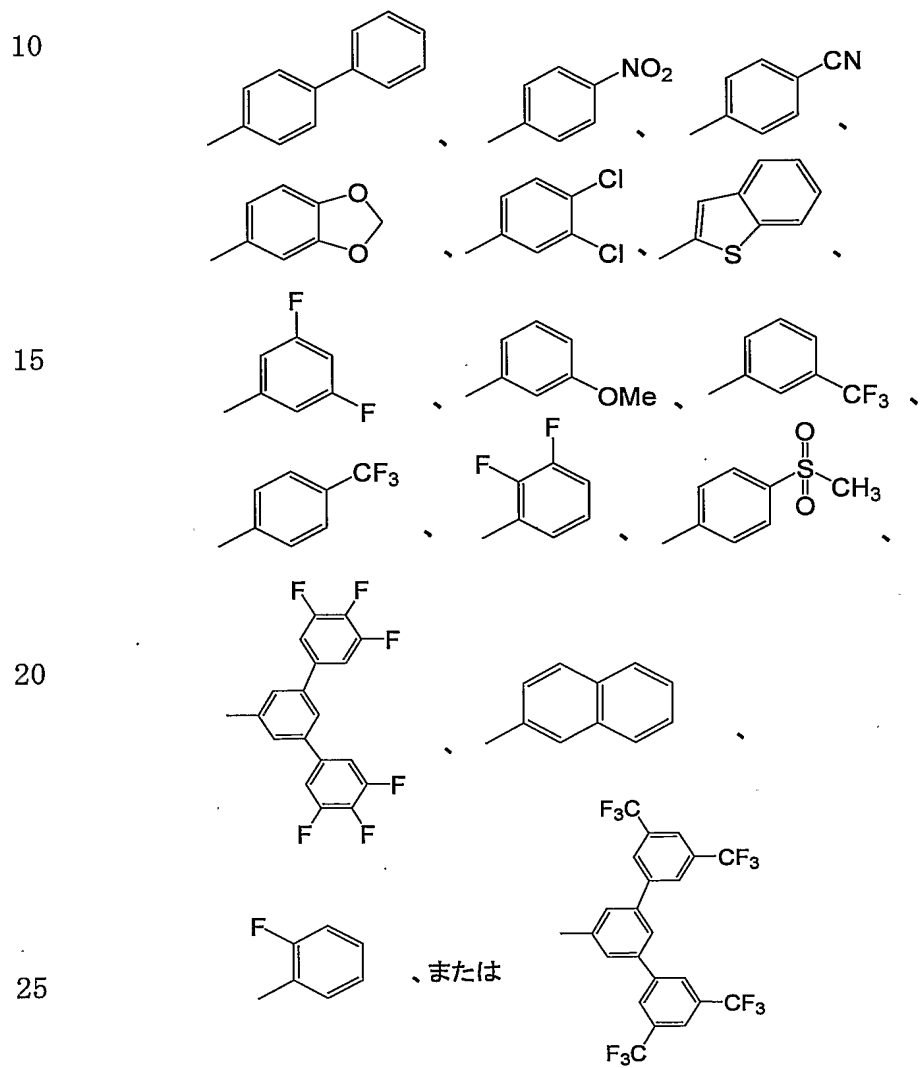
表 7

	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 8.15 (2H, s, Ar-H), 8.07 (2H, d, <i>J</i> = 7.9 Hz, Ar-H), 7.76 (4H, brs, Ar-H), 7.70–7.65 (6H, m, Ar-H), 7.44–7.33 (4H, m, Ar-H), 5.21 (2H, d, <i>J</i> = 13.7 Hz, Ar-CH ₂), 3.75 (2H, d, <i>J</i> = 13.7 Hz, Ar-CH ₂), 3.29 (2H, t, <i>J</i> = 12.7 Hz, N-CH ₂ -CH ₂ -), 2.66–2.59 (2H, m, N-CH ₂ -CH ₂ -), 1.01–0.95 (6H, m, -CH ₂ -), 0.62 (6H, t, <i>J</i> = 6.7 Hz, -CH ₃), 0.38 (2H, brs, -CH ₂ -)
	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 7.98–7.96 (4H, m, Ar-H), 7.60–7.56 (2H, m, Ar-H), 7.34 (4H, brs, Ar-H), 7.26 (4H, br, Ar-H), 7.11 (2H, dd, <i>J</i> = 7.7, 7.7 Hz, Ar-H), 6.82 (1H, dd, <i>J</i> = 7.5, 7.5 Hz, Ar-H), 6.59 (2H, d, <i>J</i> = 7.9 Hz, Ar-H), 4.92 (2H, d, <i>J</i> = 13.7 Hz, Ar-CH ₂ -), 3.97 (2H, d, <i>J</i> = 13.7 Hz, Ar-CH ₂ -), 3.84–3.79 (2H, m, -CH ₂ -), 3.14–3.09 (2H, m, -CH ₂ -), 2.99–2.95 (2H, m, -CH ₂ -), 2.54–2.49 (2H, m, -CH ₂ -)
	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 8.05 (2H, s, Ar-H), 8.03 (2H, d, <i>J</i> = 8.3 Hz, Ar-H), 7.64 (2H, dd, <i>J</i> = 7.5, 7.5 Hz, Ar-H), 7.41–7.33 (4H, m, Ar-H), 7.26 (4H, br, Ar-H), 4.99 (2H, d, <i>J</i> = 13.5 Hz, Ar-CH ₂), 4.01 (2H, d, <i>J</i> = 13.5 Hz, Ar-CH ₂), 3.57–3.54 (6H, m, -CH ₂ -), 3.11 (6H, s, -OCH ₃), 3.07 (2H, d, <i>J</i> = 9.2 Hz, -CH ₂ -)

<参考例6：4級アンモニウム塩の合成のための出発物質（化合物32'）の合成（2）>



(ここで、R'''は：



であり、2つのR'''は同一であっても異なってもよい。

化合物22 (S体) と、化合物22に対して2当量のアリールボロン酸誘導体とのSuzukiのカップリング反応を、テトラヒドロフラン中、3当量の水酸化カリウムまたはリン酸カリウム、5mol%の酢酸パラジウム、
5 および1.2mol%のトリフェニルホスフィン中で7時間還流して行った。室温まで冷却した後、塩化アンモニウム飽和液を加え、エチルエーテルで抽出して、化合物31'を各収率で得た。次いで、化合物31を、ベンゼン中2当量のN-ブロモスクシンイミドおよび0.1当量の2,2'-アゾビスイソブチロニトリルを1時間還流し、濃縮した後、シリカゲルカラムクロマトグラフィーにかけて、化合物32'を各収率で得た。得られた化合物31'、32'について、具体的な各構造式と、収率およびNMRスペクトルデータとを表8～15に示す。なお、R体についても、同様の手順により調製できる。

10

表 8

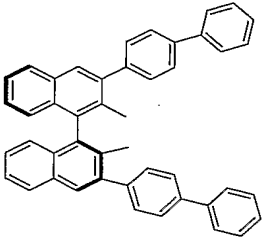
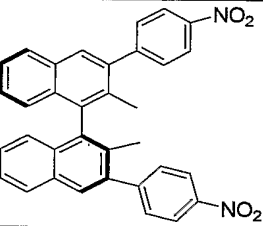
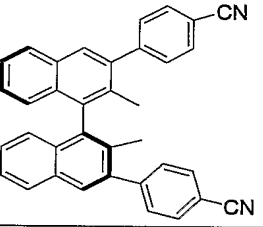
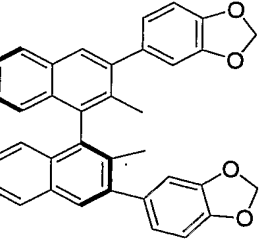
化合物31'	収率およびNMRスペクトルデータ
	収率: 74%, ^1H NMR(400MHz, CDCl_3) δ 2.03(s, 6H); 7.14(d, $J = 8.4$ Hz, 2H); 7.25–7.27(m, 2H); 7.37–7.50(m, 8H); 7.57(d, $J = 8.0$ Hz, 8H); 7.70(tr, $J = 8.0$ Hz, 2H); 7.91(d, $J = 10.0$ Hz, 4H).
	収率: 74%, ^1H NMR(400MHz, CDCl_3) δ 1.94(s, 6H); 7.11(d, $J = 8.8$ Hz, 2H); 7.29–7.32(m, 2H); 7.48(tr, $J = 7.2$ Hz, 2H); 7.67(dd, $J = 7.2$ Hz, 1.6Hz, 2H); 7.86(s, 2H); 7.93(d, $J = 8.0$ Hz, 2H); 8.33(dd, $J = 7.2$ Hz, 1.6Hz, 2H,).
	収率: 72.5%, ^1H NMR(400MHz, CDCl_3) δ 1.92(s, 6H); 7.09(d, 2H, $J = 8.8$ Hz); 7.29(tr, 2H, $J = 8.0$ Hz); 7.47(tr, $J = 7.6$ Hz, 2H); 7.60(d, $J = 8.0$ Hz, 2H); 7.77(d, $J = 8.0$ Hz, 2H); 7.83(s, 2H); 7.91(d, $J = 8.4$ Hz, 2H,).
	収率: 77%, ^1H NMR(400MHz, CDCl_3) δ 1.94(s, 6H); 6.02(s, 4H); 6.83–6.98 (m, 6H); 7.07(d, $J = 8.4$ Hz, 2H); 7.20–7.25 (m, 2H); 7.41(tr, $J = 7.6$ Hz, 2H); 7.81(s, 2H); 7.87(d, $J = 8.4$ Hz, 2H).

表 9

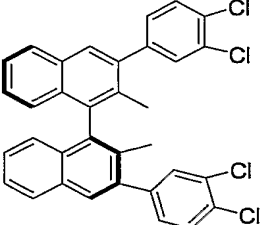
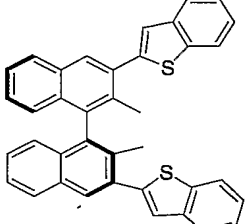
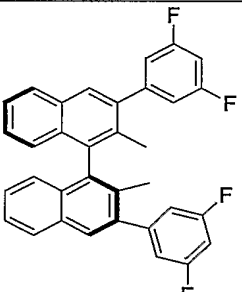
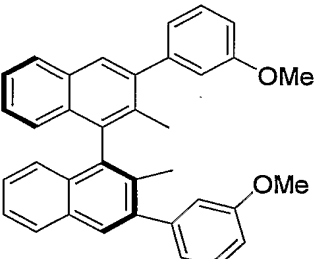
化合物31'	収率およびNMRスペクトルデータ
	収率: 69%, ^1H NMR(400MHz, CDCl_3) δ 1.92(s, 6H); 7.07(d, J = 8.4Hz, 2H); 7.27–7.33(m, 4H); 7.45(tr, J = 7.6Hz, 2H); 7.53(d, J = 8.4Hz, 2H); 7.58(d, J = 2.0Hz, 2H); 7.61(s, 2H); 7.89(d, J = 8.0Hz, 2H).
	収率: 73%, ^1H NMR(400MHz, CDCl_3) δ 2.16(s, 6H); 7.11(d, J = 8.4Hz, 2H); 7.27–7.29(m, 2H); 7.34–7.47(m, 8H); 7.83(dd, J = 7.0Hz, 0.8Hz, 2H); 7.88–7.93(m, 4H); 8.18(s, 2H).
	収率: 93%, ^1H NMR(400MHz, CDCl_3) δ 1.94 (s, 6H); 6.83 –6.88 (m, 2H); 7.00–7.05 (m, 4H); 7.08 (d, J = 8.4Hz, 2H); 7.26–7.31(m, 2H); 7.44–7.48 (m, 2H); 7.84 (s, 2H); 7.91(d, J = 8.4Hz, 2H).
	収率: 60%, ^1H NMR(400MHz, CDCl_3) δ 1.95(s, 6H); 3.87(s, 6H); 6.91–6.94 (m, 2H); 7.02–7.11(m, 6H); 7.21–7.25 (m, 2H); 7.35–7.43(m, 4H); 7.84–7.89 (m, 4H).

表 10

化合物31'	収率およびNMRスペクトルデータ
<div data-bbox="362 468 646 709"> </div>	収率: 91%, ^1H NMR (400MHz, CDCl_3): δ 1.94(s, 6H); 7.11(d, $J = 8.4$ Hz, 2H); 7.26–7.31(m, 2H); 7.44–7.48(m, 2H); 7.58 (d, $J = 8.0$ Hz, 2H); 7.64–7.68 (m, 4H); 7.76 (s, 2H); 7.85 (s, 2H); 7.91 (tr, $J = 8.4$ Hz, 2H).
<div data-bbox="345 720 659 982"> </div>	収率: 81%, ^1H NMR(400MHz, CDCl_3): δ 1.94(s, 6H); 7.11(d, $J = 8.8$ Hz, 2H); 7.26–7.32(m, 2H); 7.43–7.45(m, 2H); 7.59(d, $J = 8.4$ Hz, 4H); 7.71(d, $J = 8.4$ Hz, 4H); 7.83(s, 2H); 7.89(d, $J = 8.0$ Hz, 2H).
<div data-bbox="358 993 643 1289"> </div>	収率: 83%, ^1H NMR(400MHz, CDCl_3): δ 1.86(s, 6H); 6.90–7.02(m, 4H); 7.10–7.13(m, 2H); 7.27(d, $J = 8.0$ Hz, 2H); 7.43(tr, $J = 8.0$ Hz, 4H); 7.83(s, 2H); 7.89(d, $J = 8.0$ Hz, 2H).
<div data-bbox="345 1297 646 1612"> </div>	収率: 61%, ^1H NMR(400MHz, CDCl_3): δ 1.94(s, 6H); 3.15(s, 6H); 7.11(d, $J = 8.4$ Hz, 2H); 7.30(tr, $J = 7.6$ Hz, 2H); 7.47(tr, $J = 7.6$ Hz, 2H); 7.70(d, $J = 8.0$ Hz, 4H); 7.85(s, 2H); 7.92(d, $J = 8.0$ Hz, 4H); 8.05(d, $J = 8.0$ Hz, 4H).

表 1 1

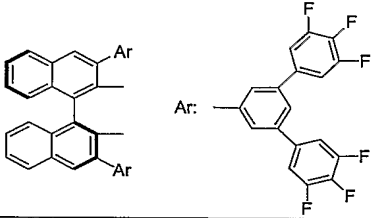
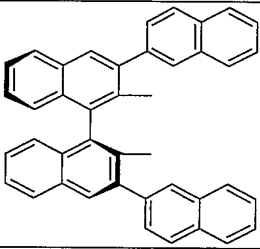
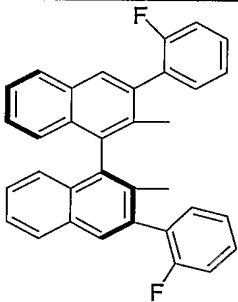
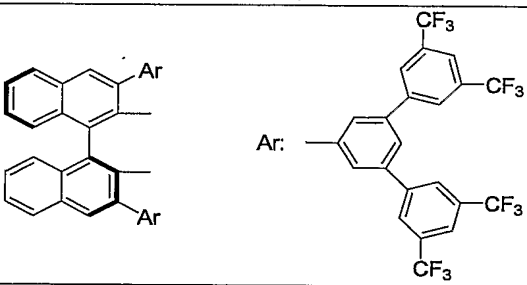
化合物31'	収率およびNMRスペクトルデータ
	収率: 42%, ^1H NMR(400MHz, CDCl_3) δ 1.94 (s, 6H); 6.88–6.91(m, 2H); 6.88 –6.91(m, 2H); 7.08 (d, J = 4.2Hz, 4H); 7.16 (d, J = 8.4Hz, 2H); 7.32 (tr, J = 7.6Hz, 2H); 7.37 (s, 8H); 7.50 (tr, J = 7.6Hz, 2H); 7.90 (s, 2H); 7.95 (d, J = 8.4Hz, 2H).
	収率: 70%, ^1H NMR(400MHz, CDCl_3) δ 2.02 (s, 6H); 7.19 (d, J = 8.8Hz, 2H); 7.27–7.31(m, 2H); 7.43–7.47 (m, 2H); 7.50–7.54 (m, 4H); 7.62 (dd, J = 8.4Hz, 2.0Hz); 7.90–7.97 (m, 4H).
	収率: 83%, ^1H NMR(400MHz, CDCl_3) δ 1.92 (s, 6H); 7.16–7.20 (m, 4H); 7.26–7.28 (m, 4H); 7.32–7.49(m, 6H); 7.88(s, 2H), 7.91(d, J = 8.0Hz, 2H).
	収率: 73%, ^1H NMR(400MHz, CDCl_3) δ 2.05 (s, 6H); 7.18(d, J = 8.4Hz, 2H); 7.31–7.35(m, 4H); 7.47–7.51(m, 2H); 7.77(dd, J = 4.4Hz, 1.6Hz, 4H); 7.93(s, 4H); 7.95(s, 2H); 7.97(s, 2H); 8.11(s, 8H).

表 1 2

化合物32'	収率およびNMRスペクトルデータ
<div data-bbox="321 514 625 793"> </div>	<p>収率: 86%, ^1H NMR(400MHz, CDCl_3) δ 4.36(s, 4H); 7.30(d, J = 8.0Hz, 2H); 7.32(tr, J = 8.0Hz, 2H); 7.38(tr, J = 8.0Hz, 2H); 7.48–7.55(m, 6H); 7.69–7.76(m, 12H); 7.95(tr, J = 8.0Hz, 4H).</p>
<div data-bbox="321 793 625 1060"> </div>	<p>収率: 81%, ^1H NMR(400MHz, CDCl_3) δ 2.04(s, 6H); 4.20(s, 4H); 7.17(d, J = 8.0Hz, 2H); 7.35–7.36(m, 2H); 7.58(tr, J = 4.0Hz, 2H); 7.81(dd, J = 6.8Hz, 1.6Hz, 4H); 7.93(s, 2H); 7.96(d, J = 8.0Hz, 2H); 8.37(d, J = 8.0Hz, 4H).</p>
<div data-bbox="321 1060 625 1318"> </div>	<p>収率: 84%, ^1H NMR(400MHz, CDCl_3) δ 4.18(s, 4H); 7.15(d, J = 8.8Hz, 2H); 7.32–7.36(m, 2H); 7.56(tr, J = 8.8Hz, 2H); 7.74(d, J = 8.0Hz, 4H); 7.80(d, J = 8.0Hz, 4H); 7.89(s, 2H); 7.94(d, J = 8.0Hz, 2H).</p>
<div data-bbox="321 1318 625 1575"> </div>	<p>収率: 71%, ^1H NMR(400MHz, CDCl_3) δ 4.28(s, 4H); 6.92(d, J = 8.4Hz, 2H); 7.06(d, J = 8.0Hz, 2H); 7.11(s, 2H); 7.13(d, J = 8.4Hz, 2H); 7.28(d, J = 7.6Hz, 2H); 7.51(tr, J = 8.4Hz, 2H); 7.87(s, 2H); 7.89(d, J = 8.4Hz, 2H).</p>

表 1 3

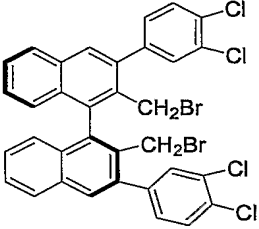
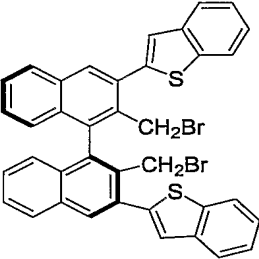
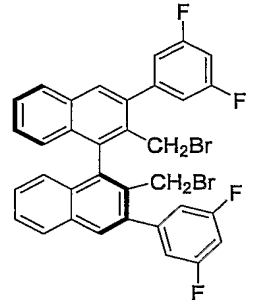
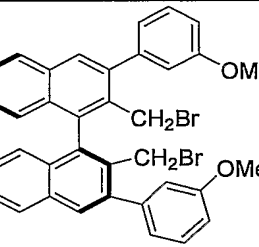
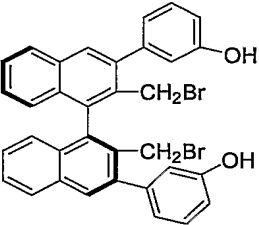
化合物32'	収率およびNMRスペクトルデータ
	収率: 84%, ^1H NMR(400MHz, CDCl_3) δ 4.19(s, 4H); 7.13(d, $J = 8.4$ Hz, 2H); 7.32(tr, $J = 7.6$ Hz, 2H); 7.47(dd, $J = 8.4$ Hz, 2H, 2H); 7.53–7.58(m, 4H); 7.88(s, 2H); 7.92(d, $J = 8.4$ Hz, 2H).
	収率: 67%, ^1H NMR(400MHz, CDCl_3) δ 4.48 (s, 4H); 7.17 (d, $J = 8.4$ Hz, 2H); 7.31 –7.43 (m, 6H); 7.52–7.57 (m, 2H); 7.70 (s, 2H); 7.85–7.90 (m, 4H); 7.94 (d, $J = 8.4$ Hz, 2H); 8.19 (s, 2H).
	収率: 89%, ^1H NMR(400MHz, CDCl_3) δ 4.20(d, $J = 10$ Hz, 2H); 4.23(d, $J = 10$ Hz, 2H); 6.87–6.93(m, 2H); 7.13–7.18(m, 6H); 7.32(tr, $J = 8.0$ Hz, 2H); 7.54(tr, $J = 8.0$ Hz, 2H); 7.90(s, 2H); 7.92(d, $J = 8.4$ Hz, 2H).
	収率: 84%, ^1H NMR (400MHz, CDCl_3) δ 3.87 (s, 6H); 4.29 (s, 4H); 6.97–7.00 (m, 2H); 7.15–7.21(m, 6H); 7.27–7.31(m, 2H); 7.39 (tr, $J = 8.4$ Hz, 2H); 7.49–7.53 (m, 2H); 7.91(d, $J = 8.4$ Hz, 2H); 7.92(s, 2H).
	収率: 81%, ^1H NMR (400MHz, CDCl_3) δ 4.27(s, 4H); 6.90–6.93(m, 2H); 7.10–7.17(m, 6H); 7.25–7.29(m, 2H); 7.34(tr, $J = 8.0$ Hz, 2H); 7.48–7.52(m, 2H); 7.89(d, $J = 8.0$ Hz, 2H); 7.90(s, 2H).

表 1 4

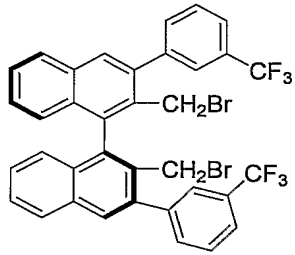
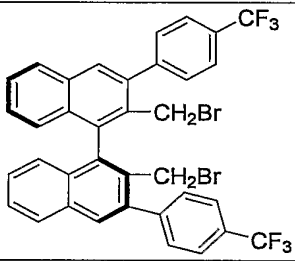
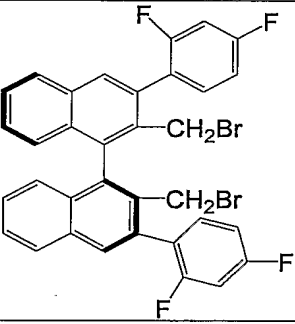
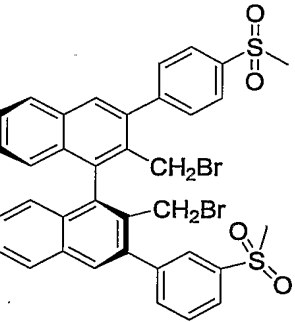
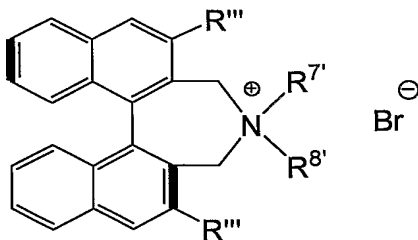
化合物32'	収率およびNMRスペクトルデータ
	収率: 80%, ^1H NMR(400MHz, CDCl_3) δ 4.12(s, 4H); 7.10 (d, $J = 8.4\text{Hz}$, 2H); 7.24–7.28(m, 2H); 7.48(tr, $J = 7.2\text{Hz}$, 2H); 7.55(tr, $J = 8.0\text{Hz}$, 2H); 7.64(d, $J = 8.0\text{Hz}$, 2H); 7.76(d, $J = 8.0\text{Hz}$, 2H); 7.83–7.87(m, 6H).
	収率: 85%, ^1H NMR(400MHz, CDCl_3) δ 4.22(s, 4H); 7.17(d, $J = 8.0\text{Hz}$, 2H); 7.31–7.35(m, 2H); 7.53–7.57(m, 2H), 7.76(tr, $J = 6.4\text{Hz}$, 8H), 7.91(s, 2H); 7.93(d, $J = 8.0\text{ Hz}$, 2H).
	測定せず
	収率: 83%, ^1H NMR(400MHz, CDCl_3) δ 3.16(s, 6H); 4.20(s, 4H); 7.17(d, $J = 8.4\text{Hz}$, 2H); 7.33–7.37(m, 2H); 7.57(tr, $J = 7.6\text{Hz}$, 2H); 7.85(d, $J = 8.4\text{Hz}$, 4H); 7.91(s, 2H); 7.95(d, $J = 8.4\text{Hz}$, 2H); 8.09(d, $J = 8.4\text{Hz}$, 4H).

表 1 5

化合物32'	収率およびNMRスペクトルデータ
<div data-bbox="329 489 792 768"> </div>	測定せず
<div data-bbox="415 768 704 1047"> </div>	収率: 66%, ^1H NMR(400MHz, CDCl_3) δ 4.35(s, 4H); 7.23(d, J = 8.8Hz, 2H); 7.33(tr, J = 7.6Hz, 2H); 7.52–7.56(m, 6H); 7.76(d, J = 8.4Hz, 2H); 7.92–7.96(m, 8H); 7.99(d, J = 8.8Hz, 2H); 8.10(s, 2H).
<div data-bbox="431 1047 688 1371"> </div>	測定せず
<div data-bbox="282 1371 831 1659"> </div>	収率: 81%, ^1H NMR(400MHz, CDCl_3) δ 4.32(d, J = 10.0Hz, 2H); 3.56(d, J = 10.0Hz, 2H); 7.24(d, J = 8.4Hz, 2H); 7.37–7.41(m, 2H); 7.58–7.62(m, 2H); 7.88(tr, J = 5.6Hz, 2H); 7.94(s, 4H); 8.00(d, J = 1.6Hz, 6H); 8.06(s, 2H); 8.17(s, 8H).

<実施例 17 : 4 級アンモニウム塩 (化合物 33') の合成 (2) >



(33')

上記参考例 6 で得られた化合物 32' (S 体) を用いて、上記実施例 1 の
ジブチルアミンを用いて、上記実施例 1 と同様の手順を行った。シリカゲル
カラムクロマトグラフィーに付して精製し、それぞれ良好な収率で化合物 3
3' を得た。なお、R 体についても、同様の手順により調製できる。

得られた化合物 33' の具体的な構造式および NMR スペクトルデータを
表 16 ~ 19 に示す。

表 1 6

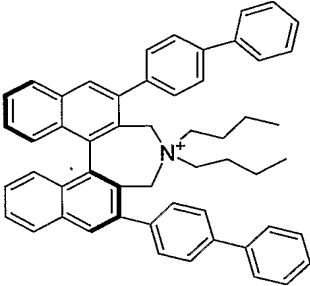
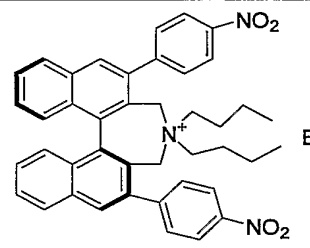
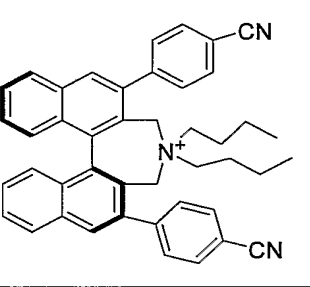
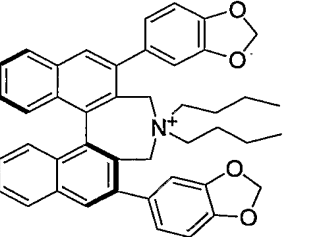
化合物33'	収率およびNMRスペクトルデータ
<div style="display: flex; align-items: center;">  <div style="margin-left: 10px;">Br-</div> </div>	収率: 81%, ^1H NMR(400MHz, CDCl_3) δ 0.26(br, 2H); 0.82(tr, $J = 7.2\text{Hz}$, 6H); 0.84–1.64 (m, 6H); 2.62(tr, $J = 13.2\text{Hz}$, 2H); 3.12(d, $J = 13.2\text{Hz}$, 2H); 3.69(d, $J = 14.0\text{Hz}$, 2H); 5.18(d, $J = 14.0\text{Hz}$, 2H); 7.35–7.40(m, 6H); 7.46(tr, $J = 8.0\text{Hz}$, 4H); 7.63–7.69(m, 10H); 7.84(m, 4H); 8.05(d, $J = 8.0\text{Hz}$, 2H); 8.14(s, 2H).
<div style="display: flex; align-items: center;">  <div style="margin-left: 10px;">Br-</div> </div>	収率: 52%, ^1H NMR(400MHz, CDCl_3) δ 0.15–0.22(m, 2H); 0.60(tr, $J = 7.2\text{Hz}$, 6H); 0.87–1.01(m, 6H); 2.55–2.63(m, 2H); 3.25(tr, $J = 13.2\text{Hz}$, 2H); 3.80(d, $J = 14.0\text{Hz}$, 2H); 5.05(d, $J = 14.0\text{Hz}$, 2H); 7.37(d, $J = 8.8\text{Hz}$, 2H); 7.45(tr, $J = 7.6\text{Hz}$, 2H); 7.70(tr, $J = 7.6\text{Hz}$, 2H); 7.85(d, $J = 8.8\text{Hz}$, 2H); 8.08(d, $J = 8.4\text{Hz}$, 2H); 8.12(s, 2H); 8.46(d, $J = 8.4\text{Hz}$, 4H).
<div style="display: flex; align-items: center;">  <div style="margin-left: 10px;">Br-</div> </div>	収率: 78%, ^1H NMR(400MHz, CDCl_3) δ 0.17–0.19 (m, 2H), 0.66 (tr, $J = 7.2\text{Hz}$, 6H); 0.84–0.87 (m, 2H); 0.94–1.00 (m, 4H); 2.52 (tr, $J = 8.4\text{Hz}$, 2H); 3.23 (tr, $J = 12.4\text{Hz}$, 2H); 3.73 (d, $J = 14.4\text{Hz}$, 2H); 5.03 (d, $J = 14.4\text{Hz}$, 2H); 7.34 (d, $J = 8.4\text{Hz}$, 2H); 7.40–7.44 (m, 2H); 7.68 (tr, $J = 7.2\text{Hz}$, 2H); 7.78 (d, $J = 8.0\text{Hz}$, 4H); 7.89(d, $J = 8.0\text{Hz}$, 4H); 8.06 (d, $J = 8.0\text{Hz}$, 2H); 8.09 (s, 2H).
<div style="display: flex; align-items: center;">  <div style="margin-left: 10px;">Br-</div> </div>	収率: 86%, ^1H NMR(400MHz, CDCl_3) δ 0.42 (b, 2H); 0.74(tr, $J = 6.8\text{Hz}$, 6H); 0.98–1.07 (m, 6H); 2.60–2.63 (m, 2H); 3.16–3.18 (m, 2H); 3.57–3.60 (m, 2H); 5.23–5.29 (m, 2H); 6.05 (d, $J = 12.0\text{Hz}$, 4H); 7.04–7.06 (m, 6H); 7.32–7.38 (m, 4H); 7.62(d, $J = 7.6\text{Hz}$, 2H); 8.00 (tr, $J = 8.0\text{Hz}$, 2H); 8.04 (s, 2H).

表 1 7

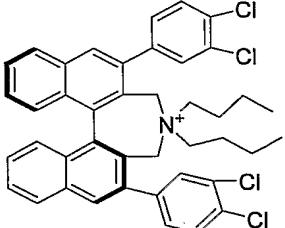
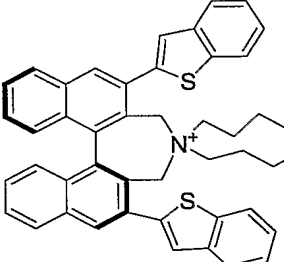
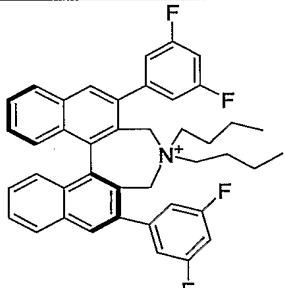
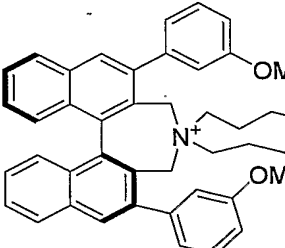
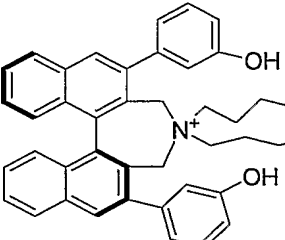
化合物33'	収率およびNMRスペクトルデータ
<div style="display: flex; align-items: center;">  <div style="margin-left: 10px;">Br-</div> </div>	収率: 65%, ^1H NMR (400MHz, CDCl_3) δ 0.23(br, 2H); 0.69(tr, $J = 7.2\text{Hz}$, 6H); 0.89–1.02 (m, 6H); 2.56(br, 2H); 3.19(br, 2H); 3.59–3.65(m, 2H); 5.05br, 2H); 7.28–7.41(m, 4H); 7.54–7.70(m, 8H); 8.25–8.11(m, 4H).
<div style="display: flex; align-items: center;">  <div style="margin-left: 10px;">Br-</div> </div>	収率: 76%, ^1H NMR(400MHz, CDCl_3) δ 0.19(tr, $J = 7.2\text{Hz}$, 6H); 0.79–0.96 (m, 8H); 2.73–2.74(m, 2H); 3.22 (tr, $J=16.0\text{Hz}$, 2H); 3.70 (d, $J = 14.0\text{Hz}$, 2H); 5.60(d, $J = 14.0\text{Hz}$, 2H); 7.33–7.43 (m, 8H); 7.66(tr, $J = 8.0\text{Hz}$, 2H); 7.86(d, $J = 7.6\text{Hz}$, 4H); 8.05(d, $J = 8.4\text{ Hz}$, 4H); 8.30(s, 2H).
<div style="display: flex; align-items: center;">  <div style="margin-left: 10px;">Br-</div> </div>	収率: 62%, ^1H NMR (400MHz, CDCl_3) δ 0.32–0.34(m, 2H); 0.71(tr, $J = 7.2\text{Hz}$, 6H); 0.99–1.09(m, 6H); 3.27(tr, $J = 12.8\text{Hz}$, 2H); 3.73(d, $J = 14.4\text{Hz}$, 2H); 5.00(d, $J = 14.4\text{Hz}$, 2H); 6.90(tr, $J = 8.8\text{Hz}$, 2H); 7.05–7.23(m, 4H); 7.23–7.39(m, 4H); 7.62(tr, $J = 8.4\text{Hz}$, 2H); 8.02(d, $J = 8.4\text{Hz}$, 2H); 8.04(s, 2H).
<div style="display: flex; align-items: center;">  <div style="margin-left: 10px;">Br-</div> </div>	収率: 79%, ^1H NMR (400MHz, CDCl_3) δ 0.20 (b, 2H); 0.65 (tr, $J = 7.2\text{Hz}$, 6H); 0.93–1.04(m, 6H); 2.62–2.64 (tr, $J = 13.2\text{Hz}$, 2H); 3.06(tr, $J = 13.2\text{Hz}$, 2H); 3.64(m, 2H); 3.91(s, 6H); 5.08(m, 2H); 7.02(d, $J = 8.0\text{Hz}$, 2H); 7.18–7.20 (m, 2H); 7.38(d, $J = 4\text{Hz}$, 4H); 7.49–7.50 (m, 2H); 7.62–7.66(m, 2H); 8.03(d, $J = 8.4\text{Hz}$, 2H); 8.08(s, 2H).
<div style="display: flex; align-items: center;">  <div style="margin-left: 10px;">Br-</div> </div>	収率: 89%, ^1H NMR (400MHz, CDCl_3) δ 0.27(br, 2H); 0.62(tr, $J = 7.2\text{Hz}$, 6H); 0.80–0.85 (br, 6H); 2.48 (br, 2H); 2.94 (br, 2H); 3.51 (br, 2H); 5.30 (br, 2H); 6.92–6.99(br, 4H); 7.24–7.32 (m, 8H); 7.52 (br, 2H); 7.98 (d, $J = 8.4\text{Hz}$, 2H); 8.04 (s, 2H); 8.47 (br, 2H).

表 1 8

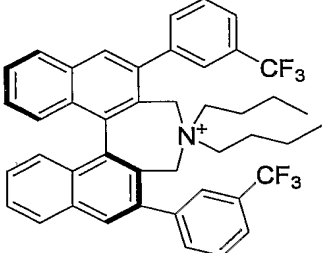
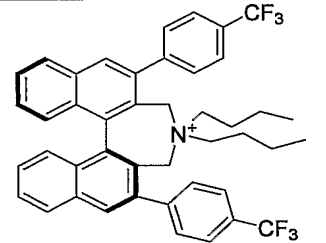
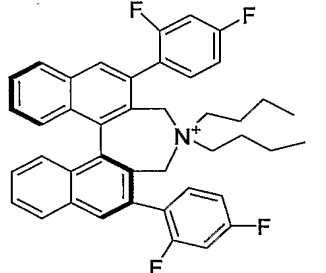
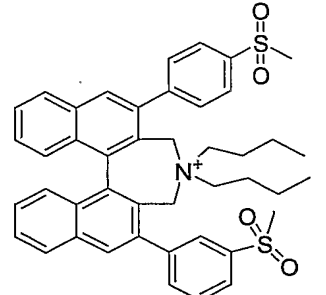
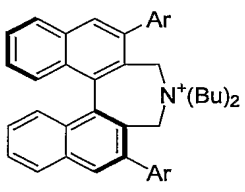
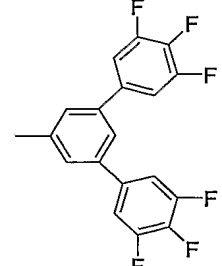
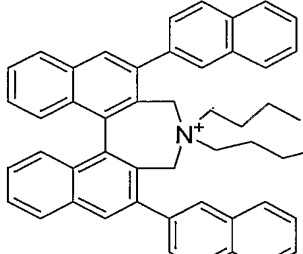
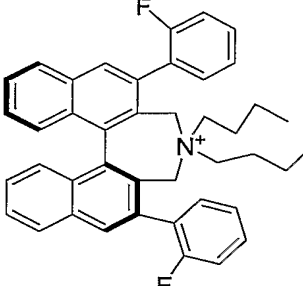
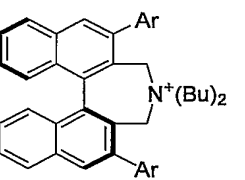
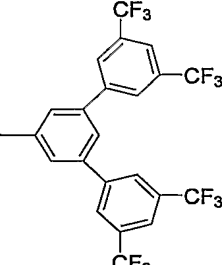
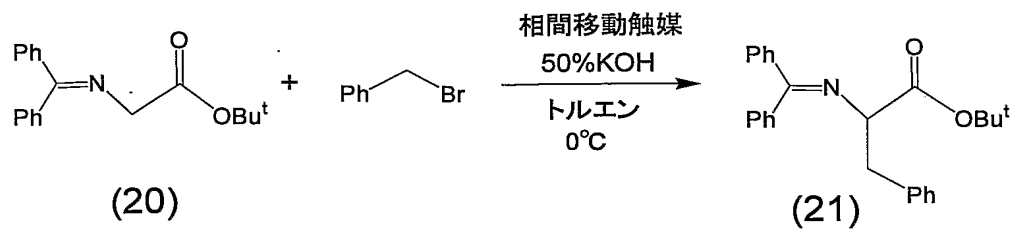
化合物33'	収率およびNMRスペクトルデータ
<div style="display: flex; align-items: center;">  <div style="margin-left: 10px;">Br⁻</div> </div>	収率: 62%, ¹ H NMR(400MHz, CDCl ₃) δ 0.15(br, 2H); 0.60 (tr, <i>J</i> = 7.2Hz, 6H); 0.72–0.98 (m, 6H); 2.59(tr, <i>J</i> = 13.2Hz, 2H); 3.15(tr, <i>J</i> = 13.2Hz, 2H), 3.75(d, <i>J</i> = 14.0Hz, 2H); 5.04(d, <i>J</i> = 14.0Hz, 2H); 7.36–7.44(m, 4H); 7.67(tr, <i>J</i> = 7.6Hz, 2H); 7.77–7.79(m, 4H); 7.87(d, <i>J</i> = 7.6Hz, 4H); 8.03–8.13(m, 4H).
<div style="display: flex; align-items: center;">  <div style="margin-left: 10px;">Br⁻</div> </div>	収率: 71%, ¹ H NMR(400MHz, CDCl ₃) δ 0.15(br, 2H); 0.61(tr, <i>J</i> = 7.2Hz, 6H); 0.74–0.98 (m, 6H); 3.20(tr, <i>J</i> = 12.8Hz, 2H); 3.75(d, <i>J</i> = 14.0Hz, 2H); 5.09(d, <i>J</i> = 14.0 Hz, 2H); 7.36(d, <i>J</i> = 8.4Hz, 2H); 7.42(tr, <i>J</i> = 7.2Hz, 2H); 7.68(tr, <i>J</i> = 7.2Hz, 2H); 7.78(d, <i>J</i> = 8.0Hz, 4H); 7.88(d, <i>J</i> = 8.0Hz, 4H); 8.06(d, <i>J</i> = 8.0Hz, 2H).
<div style="display: flex; align-items: center;">  <div style="margin-left: 10px;">Br⁻</div> </div>	収率: 73% ¹ H NMR(400MHz, CDCl ₃) δ 0.35(br, 2H); 0.72(tr, <i>J</i> = 7.2Hz, 6H); 0.89–1.08(m, 6H); 2.65–2.69(m, 2H); 3.20(tr, <i>J</i> = 12.8Hz, 2H); 3.75(d, <i>J</i> = 14.0Hz, 2H); 4.97(d, <i>J</i> = 14.0Hz, 2H); 6.91–6.99(m, 2H); 7.16(br, 4H); 7.32–7.41(m, 4H); 7.64(tr, <i>J</i> = 7.6Hz, 2H); 8.03(d, <i>J</i> = 8.0Hz, 2H); 8.11(d, <i>J</i> = 8.0Hz, 2H).
<div style="display: flex; align-items: center;">  <div style="margin-left: 10px;">Br⁻</div> </div>	収率: 75%, ¹ H NMR(400MHz, CDCl ₃) δ 0.24(br, 2H); 0.88(tr, <i>J</i> = 7.2Hz, 6H); 1.24–1.43 (m, 6H); 2.56(tr, <i>J</i> = 13.2Hz, 2H); 3.28(tr, <i>J</i> = 13.2Hz, 2H); 3.72(d, <i>J</i> = 14.0Hz, 2H); 4.97(d, <i>J</i> = 14.0Hz, 2H); 7.39(d, <i>J</i> = 8.4Hz, 2H); 7.46(tr, <i>J</i> = 7.6Hz, 2H); 7.70(tr, <i>J</i> = 7.6Hz, 2H); 7.79(br, 4H); 8.08(d, <i>J</i> = 8.4Hz, 2H); 8.11(s, 2H); 8.20(d, <i>J</i> = 8.4Hz, 4H).

表 1 9

化合物33'	収率およびNMRスペクトルデータ
<div style="display: flex; align-items: center;"> <div style="margin-right: 20px;">  </div> <div> <p>Ar: </p> </div> </div>	<p>収率: 61%, ^1H NMR(400MHz, CDCl_3) δ 0.39–0.41(m, 2H); 0.49(tr, $J = 7.2\text{Hz}$, 6H); 0.90–1.01(m, 6H); 2.75–2.80(m, 2H); 3.29(tr, $J = 12.8\text{Hz}$, 2H); 3.89(d, $J = 14.0\text{Hz}$, 2H); 5.09(d, $J = 14.0\text{Hz}$, 2H); 7.35–7.47(m, 12H); 7.63(s, 2H); 7.67–7.70(m, 2H); 7.78(d, $J = 8.8\text{Hz}$, 2H); 8.00(s, 2H); 8.08(d, $J = 8.0\text{Hz}$, 2H); 8.15(s, 2H).</p>
<div style="display: flex; align-items: center;"> <div style="margin-right: 20px;">  </div> <div> <p>Br⁻</p> </div> </div>	<p>収率: 74%, ^1H NMR(400MHz, CDCl_3) δ -0.21(br, 4H); 0.46–0.96(m, 10H); 2.62(tr, $J = 13.2\text{Hz}$, 2H); 3.00(tr, $J = 13.2\text{Hz}$, 2H); 7.75(d, $J = 14.0\text{Hz}$, 2H); 5.08(br, 2H); 7.38–7.42(m, 4H); 7.53–7.59(m, 4H); 7.65–7.69(m, 4H); 7.92(d, $J = 6.8\text{Hz}$, 4H); 8.07–8.09(m, 6H); 8.21(s, 2H).</p>
<div style="display: flex; align-items: center;"> <div style="margin-right: 20px;">  </div> <div> <p>Br⁻</p> </div> </div>	<p>収率: 45%, ^1H NMR(400MHz, CDCl_3) δ 0.42(b, 2H); 0.71(tr, $J = 7.2\text{Hz}$, 6H); 2.62–2.69 (m, 2H); 3.87–3.91(m, 2H); 4.27(d, $J = 14.0\text{Hz}$, 2H); 5.28(d, $J = 14.0\text{Hz}$, 2H); 7.22(d, $J = 8.4\text{Hz}$, 2H); 7.37–7.42(m, 6H); 7.55(tr, $J = 7.6\text{Hz}$, 2H); 7.64–7.67 (m, 2H); 7.76(tr, $J = 7.6\text{Hz}$, 2H); 8.07(d, $J = 8.4\text{Hz}$, 2H); 8.16(s, 2H).</p>
<div style="display: flex; align-items: center;"> <div style="margin-right: 20px;">  </div> <div> <p>Ar: </p> </div> </div>	<p>収率: 93%, ^1H NMR(400MHz, CDCl_3) δ 0.52(tr, $J = 7.2\text{Hz}$, 6H); 0.81–0.94(m, 8H); 2.82(tr, $J = 13.6\text{Hz}$, 2H); 3.31(tr, $J = 13.6\text{Hz}$, 2H); 3.94(d, $J = 14.0\text{Hz}$, 2H); 5.07(d, $J = 14.0\text{Hz}$, 2H); 7.47(d, $J = 3.6\text{Hz}$, 4H); 7.69–7.74 (m, 2H); 7.75(s, 2H); 7.91(d, $J = 3.6\text{Hz}$, 2H); 7.92(d, $J = 1.6\text{Hz}$, 2H); 8.05(s, 2H); 8.12(s, 2H); 8.14–8.17(m, 8H); 8.20(s, 2H).</p>

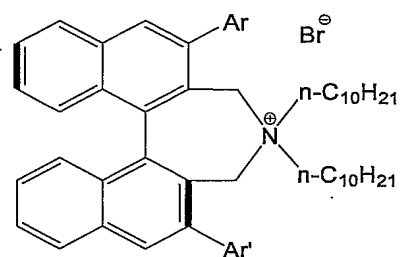
<実施例 18 : 相間移動触媒の置換基の影響の検討 (1) >



上記実施例 11 に準じて、以下の表 20 から表 22 に記載の相間移動触媒を 3 mol % 用いて 0°C にて α-ベンジル化を行った。結果を表 20 から表 22 に示す。

表 20

相間移動触媒:



10

Ar	Ar'	反応時間 (時間)	収率 (%)	光学純度 (%ee)
		1.5	65	65
		1.5	88	87
		2	65	80
		24	86	58
		1	70	64
		4	87	66

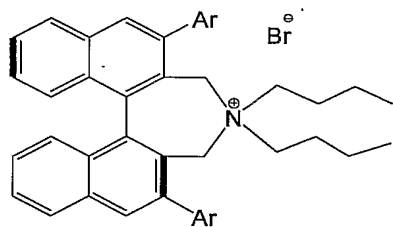
15

20

25

表 2 1

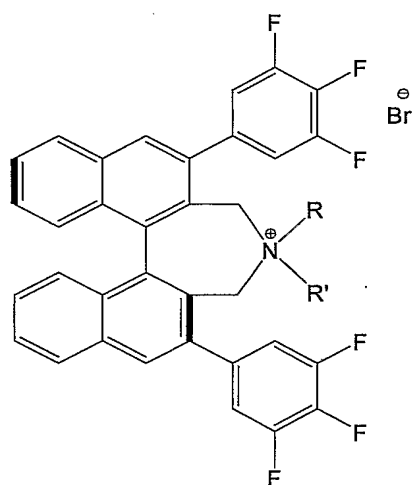
相間移動触媒:



Ar	反応時間(時間)	収率(%)	光学純度(%ee)
	7	92	82
	7	93	83
	2	97	77
	4	94	75
	21	86	97
	3	62	93
	5	97	91
	3	85	71
	3	89	89

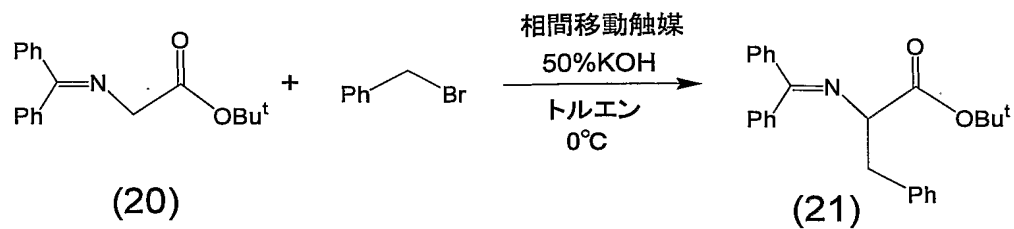
表 2 2

相間移動触媒:



	反応時間(時間)	収率(%)	光学純度(%ee)
	7	98	93
	1	78	81
	2	55	78

<実施例 19 : 相間移動触媒の置換基の影響の検討 (2) >



上記実施例 11 に準じて、以下の表 23 から表 26 に記載の相間移動触媒を 3 mol % 用いて 0°C にて α -ベンジル化を行った。結果を表 23 から表 26 に示す。

表 2 3

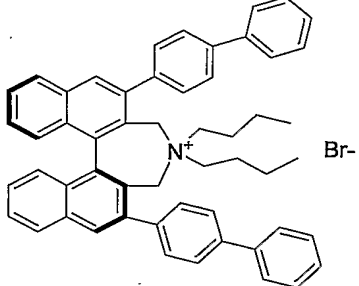
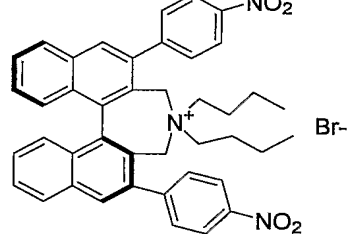
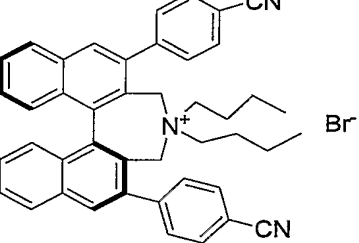
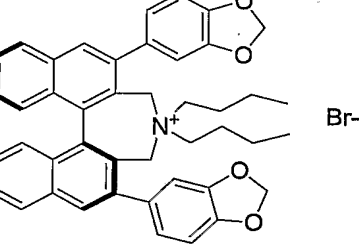
相間移動触媒	反応時間 (時間)	収率(%)	光学純度 (%ee)
	3	78	68.7
	3	88.7	92.2
	3	91	93.8
	3	86	74.5

表 2 4

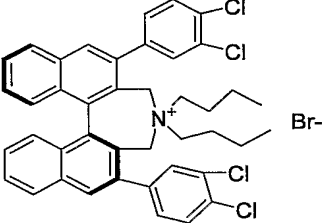
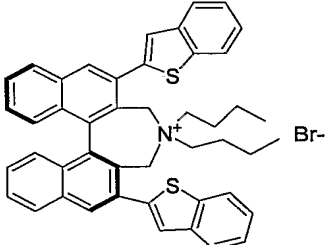
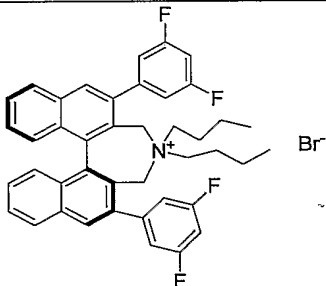
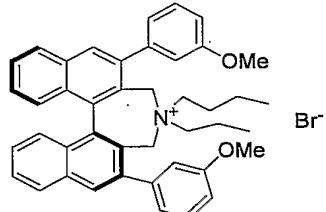
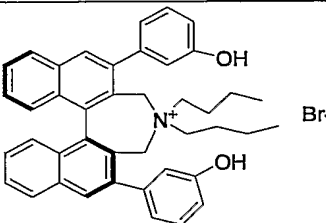
	相間移動触媒	反応時間 (時間)	収率 (%)	光学純度 (%ee)
5		3	91	86.9
10		3	71	90
15		3	94	92.8
20		3	52	73.4
25		3	85	77.8

表 2 5

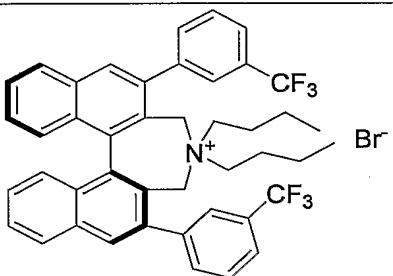
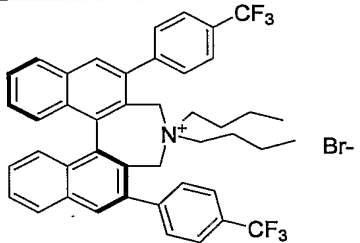
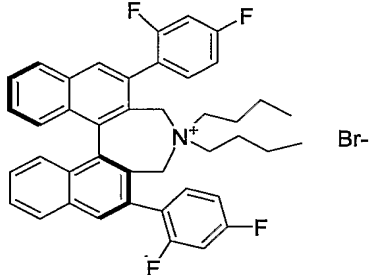
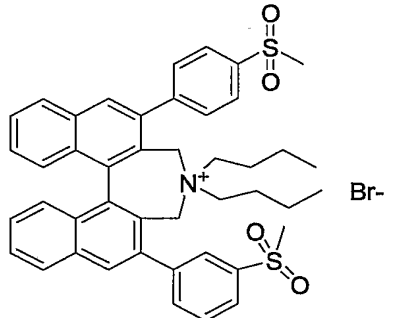
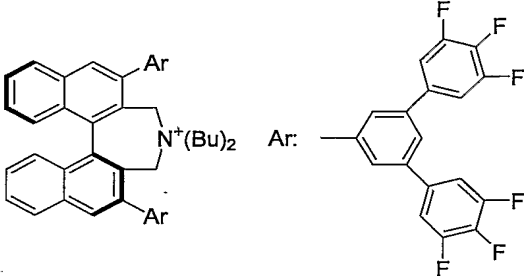
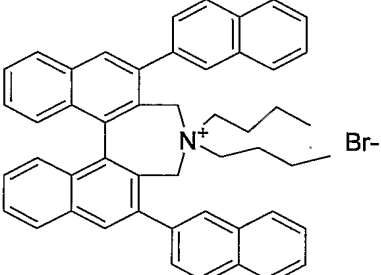
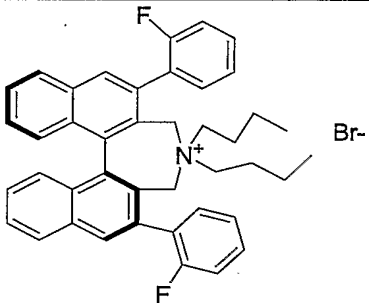
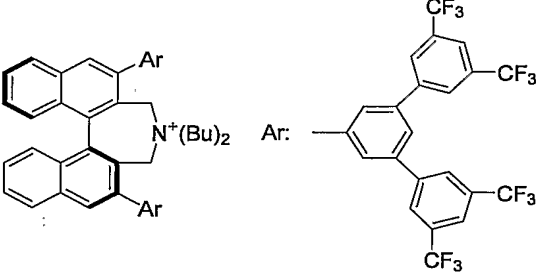
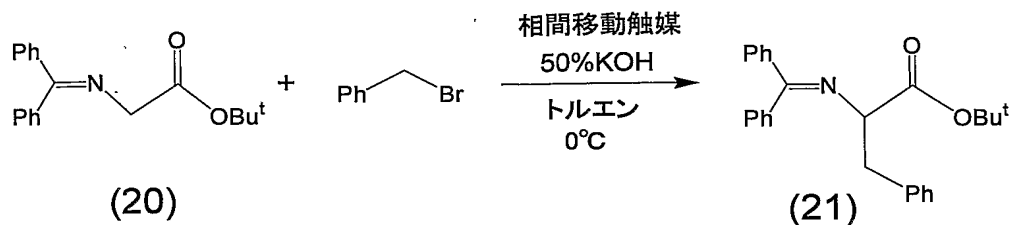
	相間移動触媒	反応時間 (時間)	収率 (%)	光学純度 (%ee)
5		3	89	82.8
10		3	89	90.5
15		3	89.8	91
20		3	83	90

表 2 6

	相間移動触媒	反応時間 (時間)	収率(%)	光学純度 (%ee)
5		3	76.5	81.05
10		3	60	77.2
15		3	92	61.6
20		3	77	81.4

<実施例 20 : 攪拌の影響の検討>

5



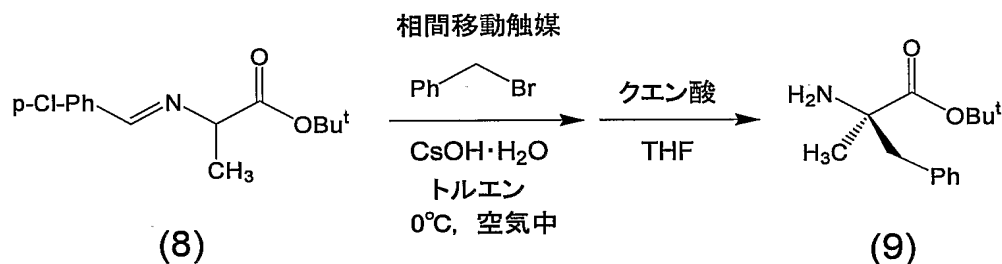
10

上記実施例 11 に準じて、相間移動触媒として化合物 16 (S 体) を 3 mmol 1% 用い、0°C にて 1 時間、より強力な攪拌子による攪拌下でベンジル化を行った。1 時間の反応時間にもかかわらず、反応混合物の HPLC 分析による収率は 78%、そしてシリカゲルカラムでの精製後の収率は 72% であり、光学純度は 99% ee であった。これは、上記表 1 に示す結果よりも反応時間が非常に短くかつ収率も高いことから、より強く攪拌することによって非常に反応効率がよくなることがわかる。

15

<実施例 21 : アラニンのベンジル化 (1)>

20

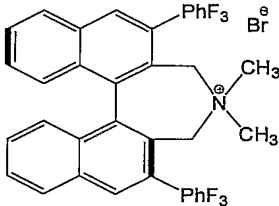
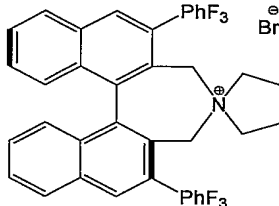
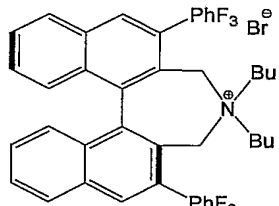
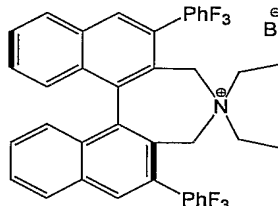
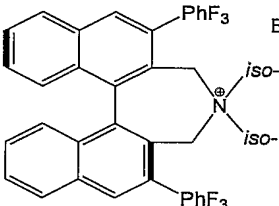
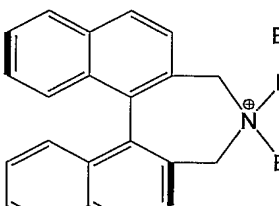
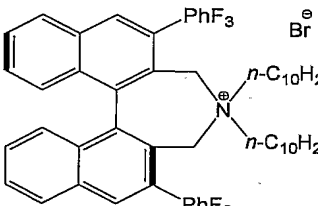
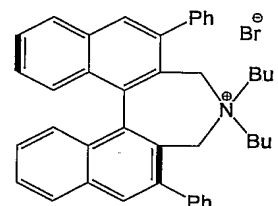
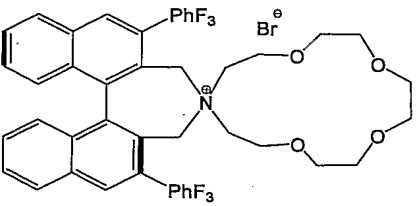
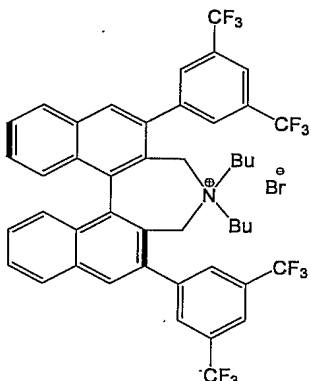


25

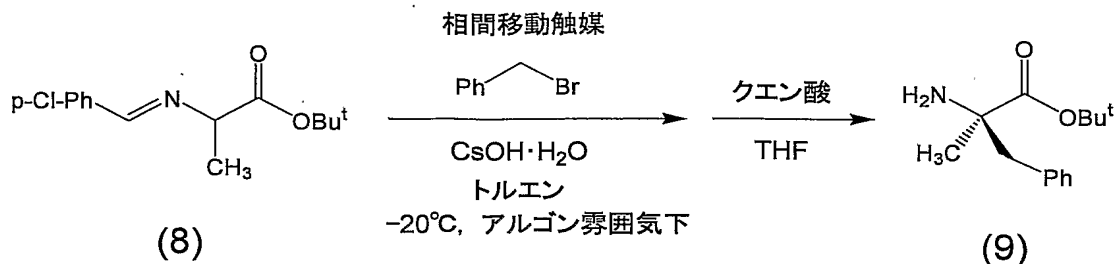
トルエン 2 mL 中のアラニン tert-ブチルエステル-p-クロロベンジルシッフ塩基 (化合物 8) (134 mg, 0.5 mmol)、以下の表 27 に記載の相間移動触媒 (3 モル%)、および臭化ベンジル (1.2 当量) の混合物に、水酸化セシウム・一水和物 (5 当量) を 0°C で加え、空気雰囲気下で 0°C にて 30 分間攪拌した (第 1 工程)。反応混合物を水に注ぎ、ジ

クロロメタンで抽出し、溶媒を留去して、テトラヒドロフラン 5 mL に溶解した。0.5 M クエン酸水溶液 5 mL を添加し、室温にて 1 時間攪拌した（第 2 工程）。水層をエーテルで洗浄し、炭酸水素ナトリウムでアルカリ性とした後、ジクロロメタンで抽出した。有機層を硫酸ナトリウムで乾燥し、濃縮して、油状物を得た。得られた油状物を、シリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶出液：酢酸エチル／ヘキサン＝2／1）にかけ、アラニンのベンジル化生成物（化合物 9）を得た。得られた生成物の光学純度は、HPLC にて分析した [D a i c e l C h i r a l c e l A D ; 溶離液：ヘキサン／イソプロパノール＝30：1、0.5 mL／分；保持時間：（R）体＝12.9 分、（S）体＝20.5 分]。収率および光学純度を表 27 に示す。

表 2 7

	相間移動触媒	収率 (%)	光学 純度 (%ee)	相間移動触媒	収率 (%)	光学 純度 (%ee)
5		58	63		72	49
10		76	97		71	80
15		65	54		65	95
20		65	95		70	61
25		72	82		70	94

<実施例 22 : アラニンのベンジル化 (2) >

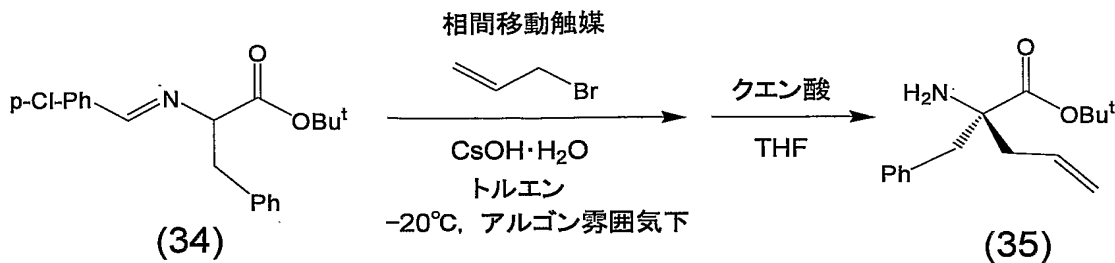


第1工程において、相間移動触媒を1mol%とし、以下の表28に記載の相間移動触媒を用い、そして反応条件をアルゴン雰囲気下-20°Cとしたこと以外は、上記実施例21と同様にアラニンのベンジル化を行った。結果を表28に示す。

表 28

相間移動触媒	収率 (%)	光学純度 (%ee)	相間移動触媒	収率 (%)	光学純度 (%ee)
	78	85		78	98
	85	99		71	67
	76	73		85	92

<実施例 23 : フェニルアラニンのアリル化>

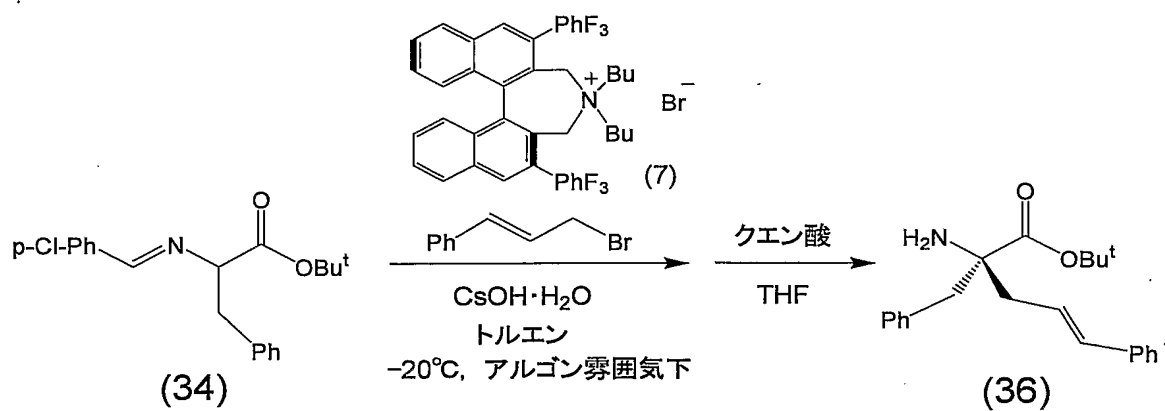


トルエン 2 mL 中のフェニルアラニン t e r t -ブチルエステル- p -クロロベンジルシッフ塩基 (化合物 34) (172 mg, 0.5 mmol)、
 以下の表 29 に記載の相間移動触媒 (1 モル%)、および臭化アリル (1.2 当量) の混合物に、水酸化セシウム・一水和物 (5 当量) を 0°C で加え、
 アルゴン雰囲気下で -20°C にて 30 分間攪拌した (第 1 工程)。反応混合物を水に注ぎ、ジクロロメタンで抽出し、溶媒を留去して、テトラヒドロフラン 5 mL に溶解した。0.5 M クエン酸水溶液 5 mL を添加し、室温にて
 1 時間攪拌した (第 2 工程)。水層をエーテルで洗浄し、炭酸水素ナトリウムでアルカリ性とした後、ジクロロメタンで抽出した。有機層を硫酸ナトリウムで乾燥し、濃縮して、油状物を得た。得られた油状物を、シリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶出液: 酢酸エチル/ヘキサン = 1/2) にかかけ、
 フェニルアラニンのアリル化生成物 (化合物 35) を得た。得られた生成物の光学純度は、HPLC にて分析した [Daicel Chiralpak
 AD; 溶離液: ヘキサン/イソプロパノール = 100:1、0.5 mL/分; 保持時間: (R) 体 = 14.9 分、(S) 体 = 20.2 分]。結果を表 29 に示す。

表 2 9

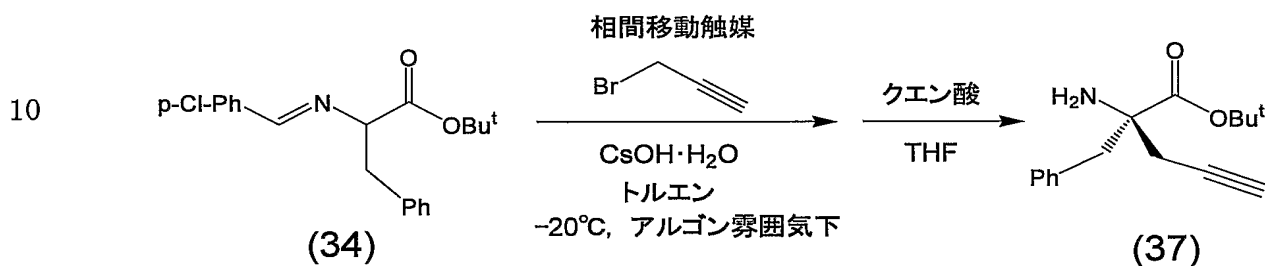
	相間移動触媒	収率 (%)	光学 純度 (%ee)	相間移動触媒	収率 (%)	光学 純度 (%ee)
5		65	70		79	95
10		76	97		72	96
15		76	74			

<実施例 2 4 : フェニルアラニンのシンナミル化>



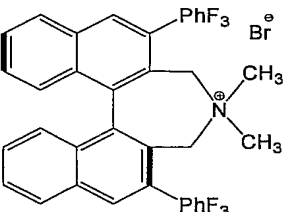
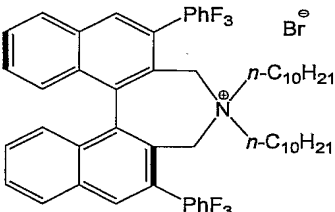
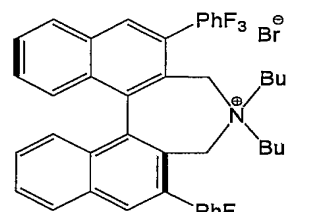
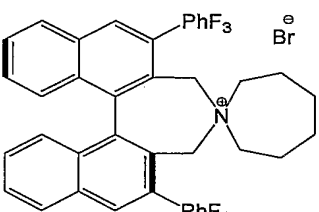
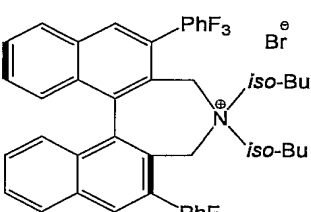
第 1 工程において、臭化アリルの代わりに臭化シンナミルを用い、相間移動触媒として化合物 7 を用いたこと以外は、上記実施例 2 3 と同様にして、フェニルアラニンのシンナミル化生成物（化合物 3 6）を得た。得られた生成物の光学純度は、HPLC にて分析した。収率は 6 9 % であり、光学純度は 9 2 % e e であった。

<実施例 2 5 : フェニルアラニンのプロパルギル化>

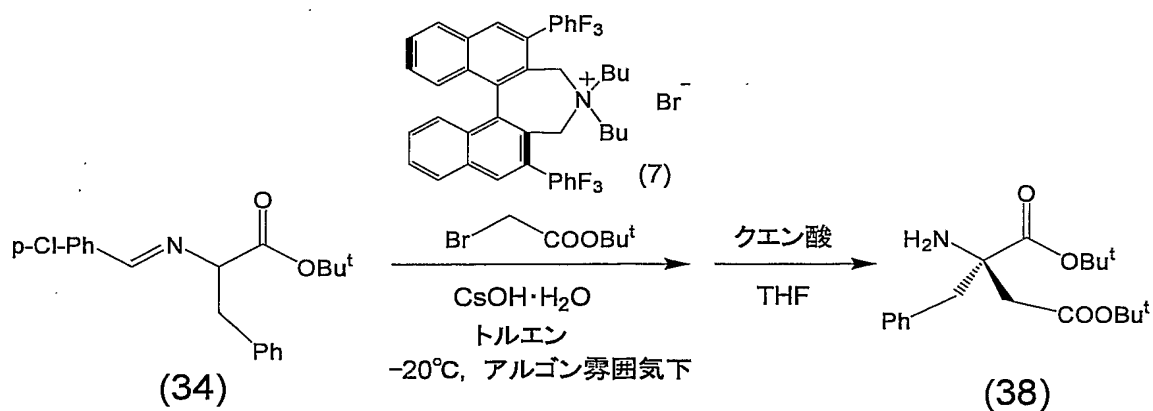


第 1 工程において、臭化アリルの代わりに臭化プロパルギルを用いたこと
15 以外は、上記実施例 2 3 と同様にして、フェニルアラニンのシンナミル化生成物（化合物 3 7）を得た。得られた生成物の光学純度は、HPLC にて分析した。結果を表 3 0 に示す。

表 3 0

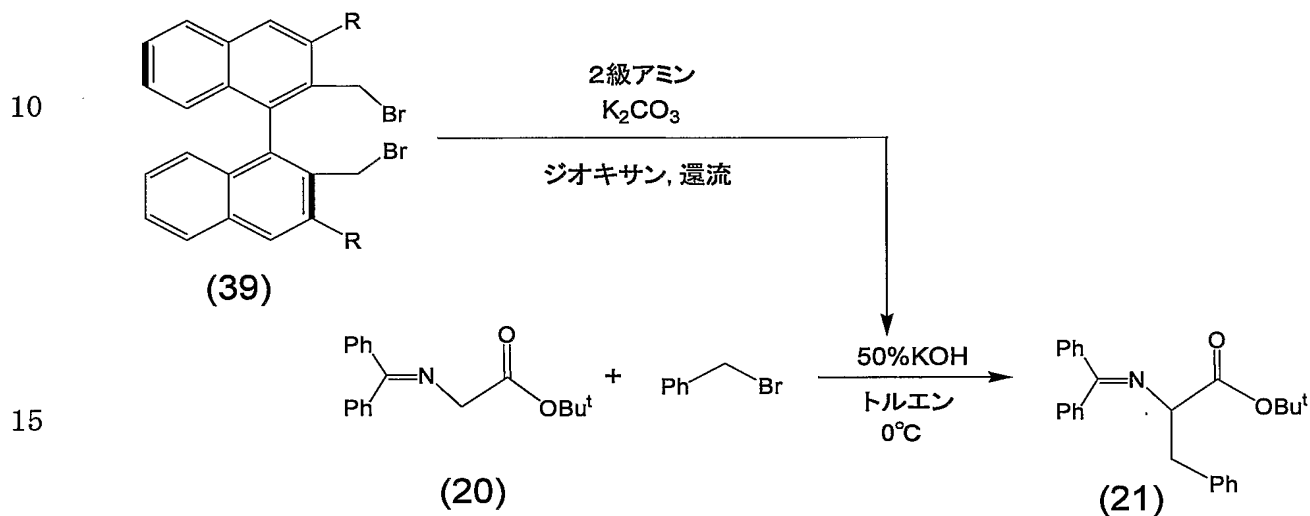
相間移動触媒	収率 (%)	光学純度 (%ee)	相間移動触媒	収率 (%)	光学純度 (%ee)
	79	63		77	91
	61	94		77	92
	67	62			

<実施例 26 : フェニルアラニンの *tert*-ブトキシカルボニルメチル化>



第1工程において、臭化アリルの代わりに α -ブロモ酢酸 *tert*-ブチルエステルを用い、相間移動触媒として化合物7を用いたこと以外は、上記実施例23と同様にして、化合物38を得た。得られた生成物の光学純度は、HPLCにて分析した。収率は66%であり、光学純度は94% eeであった。

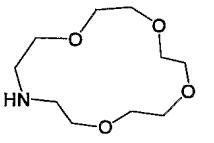
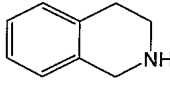
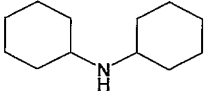

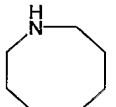
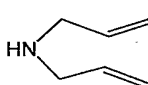
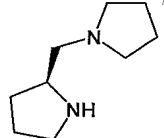
<実施例27：1容器中での触媒形成およびベンジル化反応の検討>



ジオキサン (5 mL) 中、以下の表 3 1 に記載の化合物 3 9 (S 体) (3 モル%)、以下の表 1 0 に記載の 2 級アミン (6 m o l %)、および炭酸カリウム (4. 5 m o l %) を混合し、加熱還流下で 1 0 時間攪拌した。次いで、この反応混合物に、グリシン *tert*-ブチルエステルベンゾフェノンシッフ塩基 (化合物 2 0) (1 当量、0. 5 m m o l)、5 0 % 水酸化カリウム水溶液 (1. 0 m L)、およびトルエン (3. 0 m L) を加え、さらに臭化ベンジル (1. 2 当量) を 0 °C にて滴下した。0 °C にてそれぞれ以下の表 3 1 に記載の時間攪拌した後、反応混合物を水に注ぎ、エーテルで抽出した。エーテル抽出物を飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥して、減

圧濃縮した。油状残渣を、シリカゲルカラムクロマトグラフィー（エーテル／ヘキサン＝１／１０で溶出）に付し、（Ｓ）－フェニルアラニン *tert*－ブチルエステルベンゾフェノンシッフ塩基（化合物２１）を得た。得られた生成物の光学純度は、ＨＰＬＣにて分析した〔*Dai cel Chiral cel OD*；溶離液：ヘキサン／２－プロパノール＝１００：１、０．５ｍＬ／分；保持時間：（Ｒ）体＝１４．８分、（Ｓ）体＝２８．２分〕。結果を表３１にまとめて示す。

表 3 1

2級アミン	R=H	R=Ph	R=3,5-(CF ₃) ₂ Ph	R=3,4,5-F ₃ Ph
(CH ₃) ₂ NH	12%ee (66%, 58時間)	26%ee (68%, 5日)	1%ee (57%, 30時間)	7%ee (44%, 4日)
(C ₄ H ₉) ₂ NH	-27%ee (53%, 72時間)	43%ee (89%, 54時間)	70%ee (85%, 48時間)	97%ee (76%, 24時間)
(C ₁₀ H ₂₁) ₂ NH	-17%ee (76%, 90時間)	58%ee (86%, 24時間)	96%ee (96%, 24時間)	97%ee (86%, 72時間)
(iso-C ₄ H ₉) ₂ NH	-9%ee (52%, 72時間)	22%ee (14%, 5日)	44%ee (34%, 24時間)	7%ee (65%, 4日)
	1%ee (59%, 72時間)	41%ee (86%, 36時間)	75%ee (50%, 4日)	83%ee (98%, 6時間)
	-19%ee (83%, 36時間)	-57%ee (71%, 4日)	78%ee (33%, 29時間)	81%ee (83%, 24時間)
	22%ee (44%, 51時間)	3%ee (72%, 4日)	2%ee (10%, 7日)	6%ee (13%, 6日)
	-7%ee (56%, 4日)	5%ee (78%, 24時間)	31%ee (24%, 4日)	43%ee (80%, 24時間)
	-23%ee (67%, 48時間)	33%ee (82%, 12時間)	41%ee (3%, 8日)	20%ee (72%, 48時間)
	-8%ee (54%, 24時間)	n.t.	n.t.	8%ee (23%, 7日)
	n.t.	n.t.	n.t.	10%ee (13%, 6日)

表の数値は、光学純度(%ee)を示す。

表の括弧内の数値は、収率(%)および反応時間を示す。

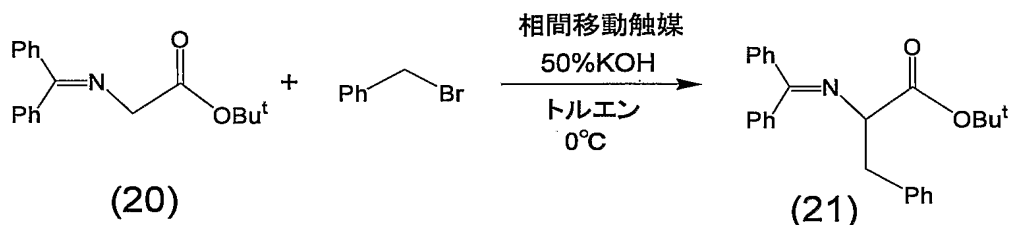
光学純度において、-の数値は、反対の立体配置の生成物が得られたことを示す。

n.t.は、実験を行っていないことを示す。

このように、相間移動触媒を単離することなく、 α -アミノ酸誘導体のアルキル化反応に使用し得ることがわかった。

<実施例 28：相間移動触媒の使用量を低減させた α -ベンジル化反応

(1) >



グリシン *tert*-ブチルエステルベンゾフェノンシッフ塩基 (化合物 20) (88.6 mg, 0.3 mmol)、化合物 20 に対して 0.05 モル%の、上記実施例 1 で得られた相間移動触媒 (化合物 7)、50%水酸化カリウム水溶液 (1.0 mL)、およびトルエン (3.0 mL) を混合して、臭化ベンジル (43 μ g, 0.36 mmol) を 0°C にて滴下した。0°C にて 4 時間にわたり激しく攪拌した後、反応混合物を水に注ぎ、エーテルで抽出した。エーテル抽出物を飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥して、減圧濃縮した。油状残渣を、シリカゲルカラムクロマトグラフィー (エーテル/ヘキサン = 1/10 で溶出) に付し、(R)-フェニルアラニン *tert*-ブチルエステルベンゾフェノンシッフ塩基 (化合物 21) を得た。得られた生成物の光学純度を、HPLC にて分析した [Daicel Chiralcel OD; 溶離液: ヘキサン/2-プロパノール = 100:1、流速 0.5 mL/分; 保持時間: (R) 体 = 14.8 分、(S) 体 = 28.2 分]。

得られた化合物 21 の収率および光学純度を表 32 に示す。

＜実施例 29：相間移動触媒の使用量を低減させた α -ベンジル化反応
(2)＞

化合物 20 に対して上記実施例 1 で得られた相間移動触媒（化合物 7）の
量を、0.01 モル%とし、反応時間を 26 時間としたこと以外は実施例 2
8 と同様にして反応を行い、(R)-フェニルアラニン *tert*-ブチルエ
ステルベンゾフェノンシッフ塩基（化合物 21）を得た。得られた化合物 2
1 の収率および光学純度を表 32 に示す。

＜実施例 30：相間移動触媒の使用量を低減させた α -ベンジル化反応
(3)＞

化合物 20 に対して上記実施例 1 で得られた相間移動触媒（化合物 7）の
量を、0.005 モル%とし、反応時間を 26 時間としたこと以外は実施例
28 と同様にして反応を行い、(R)-フェニルアラニン *tert*-ブチル
エステルベンゾフェノンシッフ塩基（化合物 21）を得た。得られた化合物
21 の収率および光学純度を表 32 に示す。

＜実施例 31：相間移動触媒の使用量を低減させた α -ベンジル化反応
(4)＞

実施例 1 で得られた相間移動触媒（化合物 7）の他に、化合物 20 に対し
て 0.05 モル%のテトラブチルアンモニウムブロミド（TBAB）を助触
媒として添加し、反応時間を 1.5 時間としたこと以外は実施例 28 と同様
にして反応を行い、(R)-フェニルアラニン *tert*-ブチルエステルベ
ンゾフェノンシッフ塩基（化合物 21）を得た。得られた化合物 21 の収率
および光学純度を表 32 に示す。

＜実施例 32：相間移動触媒の使用量を低減させた α -ベンジル化反応

(5) >

実施例1で得られた相間移動触媒（化合物7）の他に、化合物20に対して0.025モル%のテトラブチルアンモニウムブロミド（TBAB）を助触媒として添加し、反応時間を1.5時間としたこと以外は実施例28と同様にして反応を行い、（R）-フェニルアラニン *tert*-ブチルエステルベンゾフェノンシッフ塩基（化合物21）を得た。得られた化合物21の収率および光学純度を表32に示す。

<実施例33：相間移動触媒の使用量を低減させた α -ベンジル化反応

(6) >

実施例1で得られた相間移動触媒（化合物7）の他に、化合物20に対して0.0167モル%のテトラブチルアンモニウムブロミド（TBAB）を助触媒として添加し、反応時間を2時間としたこと以外は実施例28と同様にして反応を行い、（R）-フェニルアラニン *tert*-ブチルエステルベンゾフェノンシッフ塩基（化合物21）を得た。得られた化合物21の収率および光学純度を表32に示す。

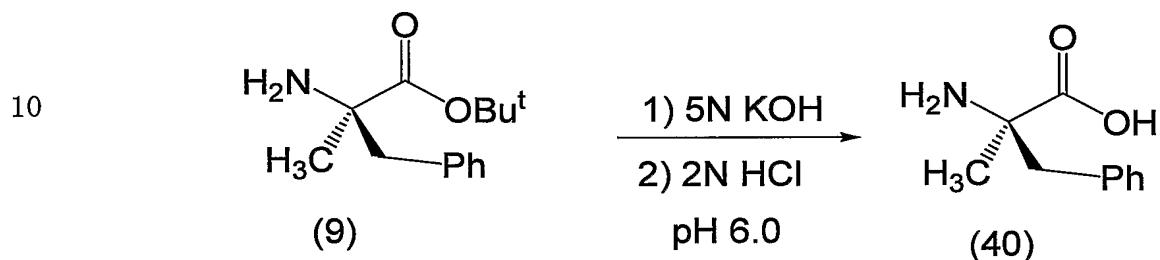
表32

	実施例1で得た相間移動触媒の使用量 (モル%)*1	TBABの使用量 (モル%)*1	反応時間 (時間)	化合物21の収率 (%)	化合物21の光学純度 (%ee)
実施例28	0.05	なし	4	87	99
実施例29	0.01	なし	26	41	97
実施例30	0.005	なし	26	29	94
実施例31	0.05	0.05	1.5	99	94
実施例32	0.05	0.025	1.5	91	95
実施例33	0.05	0.0167	2	91	96

*1…使用した化合物20の量を基準とする

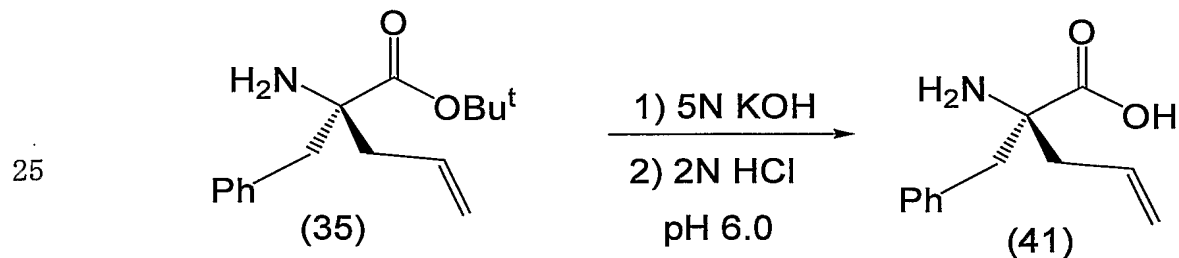
表 3 2 に示すように、実施例 2 8 ～ 3 3 に記載の方法によれば、(R) - フェニルアラニン *tert* - ブチルエステルベンゾフェノンシッフ塩基 (化合物 2 1) をさらに優れた光学純度で製造することができることがわかる。さらに、助触媒として T B A B を併用する (実施例 3 1 ～ 3 3) と、光学活
5 性な化合物 2 1 の収率を高めることができるとともに、それに至る反応時間の短縮化も達成し得ることがわかる。

< 実施例 3 4 : *tert* - ブチルエステル体の加水分解 (1) >



上記実施例 2、2 1、または 2 2 のいずれかで得られたベンジル化生成物
15 (化合物 9) に、5 N の水酸化カリウム水溶液 (当該化合物 9 に対して過剰量) を加え、4 0 °C ～ 5 0 °C の湯浴中で溶液が均一になるまで 1 時間攪拌する。室温まで放冷した後、2 N の塩酸を p H 6 . 0 になるまで加える。沈殿が生じたことを確認した後、溶液を氷冷下で 3 0 分攪拌する。沈殿をろ取し、エタノール (適量) で洗浄する。結晶を 5 0 °C で一晩乾燥させ、標題の化合物 4 0 を良好な収率かつ光学純度で得る。
20

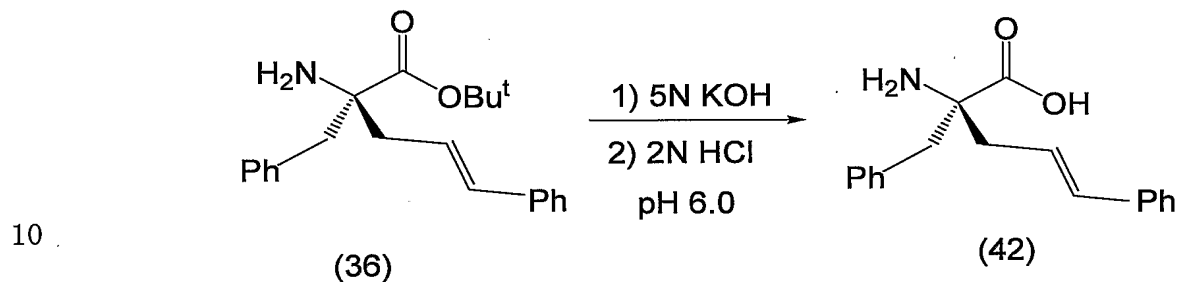
< 実施例 3 5 : *tert* - ブチルエステル体の加水分解 (2) >



上記実施例 2、21、または 22 のいずれかで得られたベンジル化生成物（化合物 9）の代わりに、実施例 23 で得られたアリル化生成物（化合物 35）を用いたこと以外は、実施例 34 と同様にして、標題の化合物 41 を良好な収率かつ光学純度で得る。

5

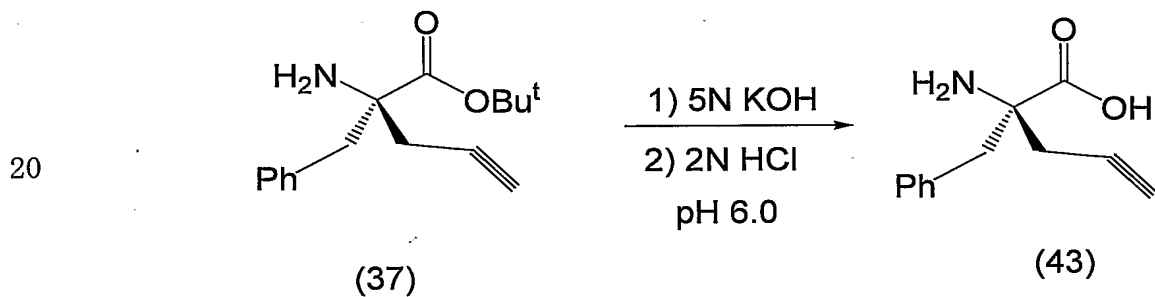
<実施例 36：tert-ブチルエステル体の加水分解（3）>



上記実施例 2、21、または 22 のいずれかで得られたベンジル化生成物（化合物 9）の代わりに、実施例 24 で得られたシンナミル化生成物（化合物 36）を用いたこと以外は、実施例 34 と同様にして、標題の化合物 42 を良好な収率かつ光学純度で得る。

15

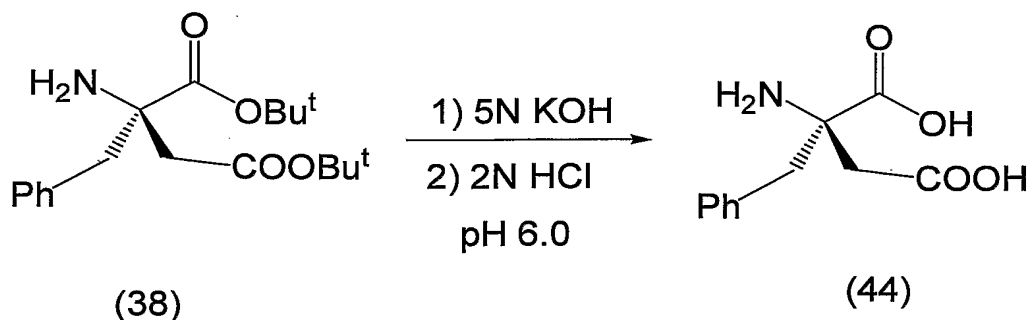
<実施例 37：tert-ブチルエステル体の加水分解（4）>



上記実施例 2、21、または 22 のいずれかで得られたベンジル化生成物（化合物 9）の代わりに、実施例 25 で得られたプロパルギル化生成物（化合物 37）を用いたこと以外は、実施例 34 と同様にして、標題の化合物 43 を良好な収率かつ光学純度で得る。

25

<実施例 38 : t e r t -ブチルエステル体の加水分解 (5)>



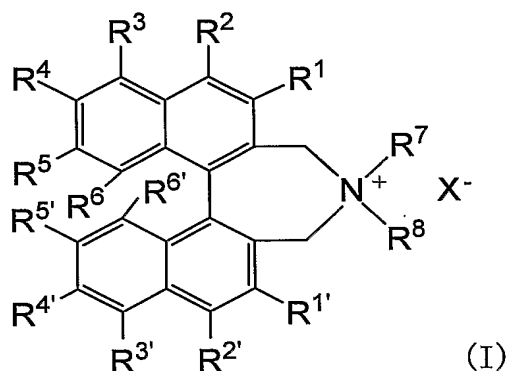
上記実施例 2、21、または 22 のいずれかで得られたベンジル化生成物
(化合物 9) の代わりに、実施例 26 で得られた t e r t -ブトキシカルボ
10 ニルメチル化生成物 (化合物 38) を用いたこと以外は、実施例 34 と同様
にして、標題の化合物 44 を良好な収率かつ光学純度で得る。

産業上の利用可能性

本発明によれば、より単純な構造のキラル相間移動触媒が提供される。こ
15 の相間移動触媒は、従来の化合物よりもより少ない工程により製造すること
ができ、このことはコストの削減にもつながる。このような相間移動触媒は、
 α -アルキル- α -アミノ酸およびその誘導体および α , α -ジアルキル-
 α -アミノ酸およびその誘導体の合成に非常に有用である。このようにして
合成されるアミノ酸およびその誘導体は、増強された特性を有するペプチド
20 の設計において、および有効な酵素インヒビターとして、ならびに種々の生
物学的活性を有する化合物の合成用のキラル構築物ブロックとして、特別な
役割を果たす。したがって、新規な食品や医薬品の開発に有用である。

請求の範囲

1. 以下の式 (I) で表される、化合物：



ここで、

R¹、R^{1'}、R²、R^{2'}、R³、R^{3'}、R⁴、R^{4'}、R⁵、R^{5'}、R⁶およびR^{6'}は、それぞれ独立して、

(i) 水素原子；

(ii) $-NR^{20}R^{21}$ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁～C₄アルキル基である)；

(iii) シアノ基；

(iv) ニトロ基；

(v) カルバモイル基；

(vi) N-(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基；

(vii) N, N-ジ(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基；

(viii) $-NHCO R^9$ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基である)；

(ix) 分岐または環を形成していてもよい、C₁～C₆のアルキル基；

(x) 分岐または環を形成していてもよい、C₂～C₆のアルケニル基；

(xi) 分岐または環を形成していてもよい、C₂～C₆のアルキニル基；

(xii) アラルキル基であって、ここで、該アラルキル基を構成するアリール部分が、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

5 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$
(ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ カルバモイル基、 N 、 N -ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル
10 基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

15 カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ カルバモイル基、

N 、 N -ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

20 ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アラルキル基；

(xiii) ヘテロアリール部分を有するヘテロアラルキル基であって、ここで、該ヘテロアリール部分が、

25 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$
(ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$
 C_4 アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)
カルバモイル基、 N, N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、ま
5 たは $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル
基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素
原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

10 ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

N, N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル
15 基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘ
テロアラールキル基；

(xiv)アリール基であって、ここで、該アリール基が、

20 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$
(ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$
 C_4 アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)
カルバモイル基、 N, N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、ま
25 たは $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル

基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

5 ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

N, N -ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

10 $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ハロゲン原子、および

$-S(O)_n-R$ (ここで、 n は0、1または2であり、そして R は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよいか、

15 あるいは3、4位が一緒になって $-O-(CH_2)_m-O-$ (ここで、 m は1または2である) で置換されていてもよい、アリール基；ならびに

(xv)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

20 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、 N, N -ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

25

シアノ基、

—NR²⁰R²¹（ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁～C₄アルキル基である）、

ニトロ基、

カルバモイル基、

5 N—（C₁～C₄アルキル）カルバモイル基、

N，N—ジ（C₁～C₄アルキル）カルバモイル基、

—NHCOR⁹（ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基である）、および

ハロゲン原子

10 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基；

からなる群より選択される基であり、

R⁷およびR⁸はそれぞれ独立して、

(i)水素原子；

15 (ii)分岐または環を形成していてもよい、C₁～C₁₂のアルキル基；

(iii)分岐または環を形成していてもよい、C₂～C₁₂のアルケニル基；

(iv)分岐または環を形成していてもよい、C₂～C₁₂のアルキニル基；

(v)アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、

20 分岐していてもよいC₁～C₅アルコキシ基、

分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、シアノ基、—NR²⁰R²¹

（ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁～C₄アルキル基である）、ニトロ基、カルバモイル基、N—（C₁～C₄アルキル）カルバモイル基、N，N—ジ（C₁～C₄アルキル）カルバモイル基、ま

25 たは—NHCOR⁹（ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基である）で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

5 カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

$N, N\text{-ジ}(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

10 ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基;

(vi)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

15 分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、 $N, N\text{-ジ}(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

20

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

25

ニトロ基、

カルバモイル基、

N- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

-NHCO R^9 (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

5 ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基；

(vii) - (CH_2) $_n$ OCO $NR^{10}R^{11}$ (ここで、 R^{10} および R^{11} はそれぞれ独立して、

10 (1) 水素原子、

(2) 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

(3) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$ のアルケニル基；

(4) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$ のアルキニル基；

(5) アラルキル基であって、該アラルキル基を構成するアリール部分

15 が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、- $NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、N, N-ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、または -NHCO R^9 (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

20 シアノ基、

25 - $NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

5 -NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アル
キル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ア
ラルキル基；

10 (6)ヘテロアリール部分を有するヘテロアラルキル基であって、該ヘ
テロアリール部分が、

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁~C₅アルコキシ基、

15 分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、シアノ基、-NR²⁰R²¹
1 (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁~
C₄アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N- (C₁~C₄アル
キル) カルバモイル基、N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、
または-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキ
ル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

20 シアノ基、

-NR²⁰R²¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、
水素原子またはC₁~C₄アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

25 N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

—NHCOR⁹（ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基である）、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアラルキル基；

(7) アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁～C₅アルコキシ基、

分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、シアノ基、—NR²⁰R²¹

（ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁～C₄アルキル基である）、ニトロ基、カルバモイル基、N—（C₁～C₄アルキル）カルバモイル基、N，N—ジ（C₁～C₄アルキル）カルバモイル基、または—NHCOR⁹（ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基である）で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

—NR²⁰R²¹（ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁～C₄アルキル基である）、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N—（C₁～C₄アルキル）カルバモイル基、

N，N—ジ（C₁～C₄アルキル）カルバモイル基、

—NHCOR⁹（ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基である）、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(8)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$

5 1 (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、 N,N -ジ $(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

10 シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

15 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

N,N -ジ $(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

20 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そして n は1から12の整数である) ;

(viii) $-(CH_2)_n CONR^{12}R^{13}$ (ここで、 R^{12} および R^{13} はそれぞれ独立して、

25

(1)水素原子、

(2)分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

(3)アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

5 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$

¹ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、 N,N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

10 シアノ基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

15 カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

N,N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

20 ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

25 分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$

¹ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、 N, N -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、または $-NHCO R^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

N, N -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

$-NHCO R^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そして n は1から12の整数である) ;

(ix) $-(CH_2)_n NR^{12}CO R^{13}$ (ここで、 R^{12} および R^{13} はそれぞれ独立して、

(1)水素原子、

(2)分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

(3)アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$
¹ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、 N, N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、
 5 または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

10 ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

N, N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

15 $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

20 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$
¹ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、 N, N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、
 25 または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

ル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

5 ニトロ基、

カルバモイル基、

N-($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

N, N-ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

$-NHCO R^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そしてnは1から12の整数である) ;

(x) $-(CH_2)_n NR^{12}R^{13}$ (ここで、 R^{12} および R^{13} はそれぞれ独立して、

(1)水素原子、

(2)分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

(3)アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N-($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、N, N-ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

または -NHCO R^9 （ここで、 R^9 は分岐していてもよい $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基である）で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$\text{-NR}^{20}\text{R}^{21}$ （ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、

5 水素原子または $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基である）、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$\text{N- (C}_1 \sim \text{C}_4\text{アルキル) カルバモイル基、}$

$\text{N, N-ジ (C}_1 \sim \text{C}_4\text{アルキル) カルバモイル基、}$

10 -NHCO R^9 （ここで、 R^9 は分岐していてもよい $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基である）、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

15 (4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $\text{C}_1 \sim \text{C}_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基、シアノ基、 $\text{-NR}^{20}\text{R}^{21}$ （ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基である）、ニトロ基、カルバモイル基、 $\text{N- (C}_1 \sim \text{C}_4\text{アルキル) カルバモイル基、}$
20 $\text{N, N-ジ (C}_1 \sim \text{C}_4\text{アルキル) カルバモイル基、}$
または -NHCO R^9 （ここで、 R^9 は分岐していてもよい $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基である）で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

25 $\text{-NR}^{20}\text{R}^{21}$ （ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基である）、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

5 -NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

10 からなる群より選択される基であり、そしてnは1から12の整数である) ;

(xi) - (CH₂)_nY-OR¹² (ここで、Yは分岐していてもよいC₁~C₄の二価の飽和炭化水素基であり、R¹²は、

(1)水素原子、

15 (2)分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

(3)アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁~C₅アルコキシ基、

20 分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、シアノ基、-NR²⁰R²¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁~C₄アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、または-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

25 シアノ基、

-NR²⁰R²¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、

水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

5 N, N-ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ア

10 リール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

15 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、-NR²⁰R²¹
 (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、N, N-ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、または-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

20 シアノ基、

-NR²⁰R²¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

25 N- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

—NHCOR⁹（ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基である）、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そしてnは1から12の整数である）；

(xii) —(CH₂)_n—OR¹²（ここで、R¹²は、

(1)水素原子、

(2)分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、

(3)アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁～C₅アルコキシ基、

分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、シアノ基、—NR²⁰R²¹

（ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁～C₄アルキル基である）、ニトロ基、カルバモイル基、N—(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、N, N—ジ(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、または—NHCOR⁹（ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基である）で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

—NR²⁰R²¹（ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁～C₄アルキル基である）、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N—(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、

N, N—ジ(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、

—NHCOR⁹（ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基である）、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁～C₅アルコキシ基、

分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、シアノ基、—NR²⁰R²¹

（ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁～C₄アルキル基である）、ニトロ基、カルバモイル基、N—（C₁～C₄アルキル）カルバモイル基、N，N—ジ（C₁～C₄アルキル）カルバモイル基、または—NHCOR⁹（ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基である）で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

—NR²⁰R²¹（ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁～C₄アルキル基である）、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N—（C₁～C₄アルキル）カルバモイル基、

N，N—ジ（C₁～C₄アルキル）カルバモイル基、

—NHCOR⁹（ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基である）、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そしてnは1から12の整数である) ;

(xiii) $-(CH_2)_n-S-R^{12}$ (ここで、 R^{12} は、

(1) 水素原子、

5 (2) 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

(3) アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$

10 21 (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、 N,N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

15 シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

20 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

N,N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

25 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であつて、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$

5 1 (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、 N,N -ジ $(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

10 シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

15 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

N,N -ジ $(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

20 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そして n は1から12の整数である) ;

(xiv) $-(CH_2)_n-SO-R^{12}$ (ここで、 R^{12} は、

25 (1)水素原子、

(2)分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

(3) アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$

5 1 (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、 N,N -ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

10 シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

15 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

N,N -ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

20 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

25 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$

1 (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim$

C₄アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N-(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基、N,N-ジ(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基、または-NHCOR⁹(ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

5 シアノ基、

-NR²⁰R²¹(ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁~C₄アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

10 N-(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基、

N,N-ジ(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基、

-NHCOR⁹(ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である)、および

ハロゲン原子

15 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そしてnは1から12の整数である) ; ならびに

(xv) -(CH₂)_n-SO₂-R¹²(ここで、R¹²は、

20 (1)水素原子、

(2)分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

(3)アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁~C₅アルコキシ基、

25 分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、シアノ基、-NR²⁰R²¹(ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁~

C₄アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N-(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基、N,N-ジ(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基、または-NHCOR⁹(ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

5

シアノ基、

-NR²⁰R²¹(ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁~C₄アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

10

N-(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基、

N,N-ジ(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基、

-NHCOR⁹(ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である)、および

ハロゲン原子

15

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁~C₅アルコキシ基、

20

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、シアノ基、-NR²⁰R²¹(ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁~C₄アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N-(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基、N,N-ジ(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基、または-NHCOR⁹(ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

25

シアノ基、

—NR²⁰R²¹（ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁～C₄アルキル基である）、

ニトロ基、

カルバモイル基、

5 N—（C₁～C₄アルキル）カルバモイル基、

N, N—ジ（C₁～C₄アルキル）カルバモイル基、

—NHCOR⁹（ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基である）、および

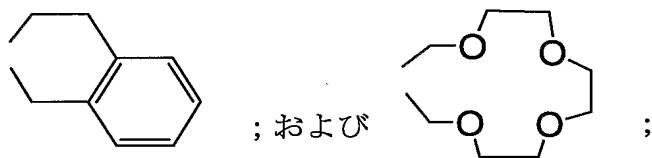
ハロゲン原子

10 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そしてnは1から12の整数である）；

からなる群より選択される基であるか、あるいは、

15 R⁷およびR⁸は一緒になって、—（CH₂）_m—（ここで、mは2から8の整数である）；



20 からなる群より選択される二価の基を表し、そして

X⁻は、ハロゲン化物アニオン、SCN⁻、HSO₄⁻、およびHF₂⁻からなる群より選択されるアニオンである。

2. 前記式（I）で表される化合物のR¹、R^{1'}、R²、R^{2'}、R³、R^{3'}、

25 R⁴、R^{4'}、R⁵、R^{5'}、R⁶およびR^{6'}が、それぞれ独立して、

(i)水素原子；

(xiv) アリール基であって、ここで、該アリール基が、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$

5 (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ カルバモイル基、 N, N -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

10 シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

15 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ カルバモイル基、

N, N -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ハロゲン原子および

20 $-S(O)_n-R$ (ここで、 n は 0、1 または 2 であり、そして R は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) ;

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよいか、あるいは 3, 4 位が一緒になって $-O-(CH_2)_m-O-$ (ここで、 m は 1 または 2 である)

25 で置換されていてもよい、アリール基 ; ならびに

(xv) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$

(ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、 N,N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

10 $-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

15 N,N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基；

20

からなる群より選択される基である、請求項1に記載の化合物。

3. 前記式(I)で表される化合物の R^1 、 $R^{1'}$ 、 R^2 、 $R^{2'}$ 、 R^3 、 $R^{3'}$ 、 R^4 、 $R^{4'}$ 、 R^5 、 $R^{5'}$ 、 R^6 および $R^{6'}$ が、それぞれ独立して、水素原子、

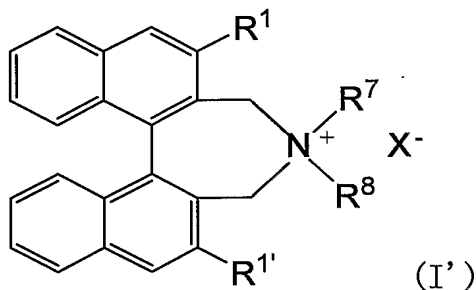
25 3, 4, 5-トリフルオロフェニル基、3, 4, 5-トリクロロフェニル基、3, 4-ジフルオロフェニル基、3-ニトロフェニル基、3-シアノフェニル

ル基、ベンゾチオフェニル-2-イル基、3, 5-ジフルオロフェニル基、
3-トリフルオロメチルフェニル基、2, 4-ジフルオロフェニル基、3-
メチルスルホニルフェニル基、および2, 3-ビス(トリフルオロメチル)
フェニル基からなる群より選択される基である、請求項2に記載の化合物。

5

4. 前記式(I)で表される化合物が、以下の式(I') :

10



15

(ここで、 R^1 および $R^{1'}$ は、それぞれ独立して、水素原子、3, 4, 5-
トリフルオロフェニル基、3, 4, 5-トリクロロフェニル基、3, 4-ジ
フルオロフェニル基、3-ニトロフェニル基、3-シアノフェニル基、ベン
ゾチオフェニル-2-イル基、3, 5-ジフルオロフェニル基、3-トリフ
ルオロメチルフェニル基、2, 4-ジフルオロフェニル基、3-メチルスル
ホニルフェニル基、および2, 3-ビス(トリフルオロメチル)フェニル基
からなる群より選択される基であり、そして R^7 、 R^8 および X^- は、それぞ
れ独立して、請求項1と同様に定義される基である)で表される化合物であ
る、請求項3に記載の化合物。

20

5. 前記式(I)で表される化合物の R^7 および R^8 がそれぞれ独立して、

(ii)分岐または環を形成していてもよい、 $C_1 \sim C_{12}$ のアルキル基；なら
びに

25

(xii) $-(CH_2)_n-OR^{12}$ (ここで、 R^{12} は、

(1)水素原子、

(2)分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

(3)アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

5 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$

¹ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、 N,N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

10 シアノ基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

15 カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

N,N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

20 ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

25 分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$

¹ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、 N, N -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

N, N -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

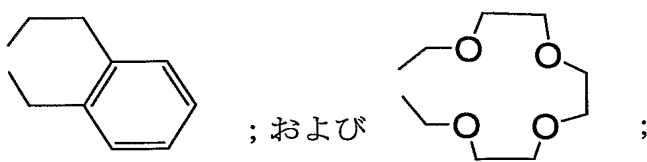
からなる群より選択される基であり、そして n は1から12の整数である) ;

からなる群より選択される基である、請求項1に記載の化合物。

6. 前記式(I)で表される化合物の R^7 および R^8 がそれぞれ独立して、メチル基、エチル基、 n -ブチル基、イソブチル基、 n -デシル基、およびシクロヘキシル基からなる群より選択される基である、請求項5に記載の化合物。

7. 前記式 (I) で表される化合物の R^7 および R^8 が同一である、請求項 6 に記載の化合物。

8. 前記式 (I) で表される化合物の R^7 および R^8 が一緒になって、 $-(CH_2)_m-$ (ここで、 m は 2 から 8 の整数である) ;

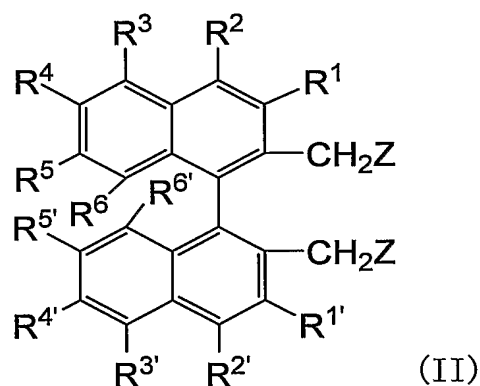


10. からなる群より選択される二価の基を表す、請求項 1 に記載の化合物。

9. 請求項 1 に記載の、式 (I) で表される化合物を製造するための方法であって、

以下の式 (I I) :

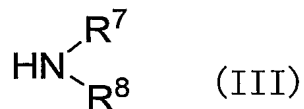
15



20

で表される化合物を、有機溶媒中、酸捕捉剤の存在下にて、

以下の式 (I I I) :



25

で表される 2 級アミンと反応させる工程、を包含し、

ここで、式 (I I) において、

R^1 、 $R^{1'}$ 、 R^2 、 $R^{2'}$ 、 R^3 、 $R^{3'}$ 、 R^4 、 $R^{4'}$ 、 R^5 、 $R^{5'}$ 、 R^6 および
 $R^{6'}$ は、それぞれ独立して、

(i) 水素原子；

5 (ii) $-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) ；

(iii) シアノ基；

(iv) ニトロ基；

(v) カルバモイル基；

10 (vi) $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基；

(vii) $N, N\text{-ジ}(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基；

(viii) $-NHCO R^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) ；

(ix) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_1 \sim C_6$ のアルキル基；

15 (x) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$ のアルケニル基；

(xi) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$ のアルキニル基；

(xii) アラルキル基であって、ここで、該アラルキル基を構成するアリー
 ル部分が、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

20 分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$

(ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、 $N, N\text{-ジ}(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、ま

たは $-NHCO R^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル

25 基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

5 カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

$N, N\text{-ジ}(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

$-NHCO R^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

10 ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アラルキル基；

(xiii)ヘテロアリール部分を有するヘテロアラルキル基であって、ここで、該ヘテロアリール部分が、

15 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、 $N, N\text{-ジ}(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、または $-NHCO R^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

20 シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

25 ニトロ基、

カルバモイル基、

N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

5 -NHCO R⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル
基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘ
テロアラルキル基;

(xiv) アリール基であって、ここで、該アリール基が、

10 分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁~C₅アルコキシ基、

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、シアノ基、-NR²⁰R²¹

(ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁~C₄
アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N- (C₁~C₄アルキ

15 ル) カルバモイル基、N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、ま
たは-NHCO R⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル
基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

20 -NR²⁰R²¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素
原子またはC₁~C₄アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

25 -NHCO R⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル
基である)、

ハロゲン原子、および

—S(O)_n—R (ここで、nは0、1または2であり、そしてRは分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基である)

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよいか、

5 あるいは3、4位が一緒になって—O—(CH₂)_m—O—(ここでmは1または2である)で置換されていてもよい、アリール基；ならびに

(xv)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁～C₅アルコキシ基、

10 分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、シアノ基、—NR²⁰R²¹

(ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁～C₄アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N—(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、N,N-ジ(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、または—NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

15

シアノ基、

—NR²⁰R²¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁～C₄アルキル基である)、

ニトロ基、

20

カルバモイル基、

N—(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、

N,N-ジ(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、

—NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基である)、および

25

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、へ

テロアリール基；

からなる群より選択される基であり、そして

Zはハロゲン原子であり、

そして式 (I I I) において、

5 R^7 および R^8 はそれぞれ独立して、

(i)水素原子；

(ii)分岐または環を形成していてもよい、 $C_1 \sim C_{12}$ のアルキル基；

(iii)分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_{12}$ のアルケニル基；

(iv)分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_{12}$ のアルキニル基；

10 (v)アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$

15 (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、 N 、 N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

20 $-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

25 N 、 N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル

基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基;

5 (vi)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$

10 (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、 N,N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

15 $-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

20 N,N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基;

25

(vii) $-(CH_2)_nOCONR^{10}R^{11}$ (ここで、 R^{10} および R^{11} はそれ

それぞれ独立して、

(1) 水素原子、

(2) 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

(3) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$ のアルケニル基；

5 (4) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$ のアルキニル基；

(5) アラルキル基であって、該アラルキル基を構成するアリール部分

が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

10 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、 N, N -ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

20 カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

N, N -ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

25 ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、ア

ラルキル基；

(6)ヘテロアリール部分を有するヘテロラルキル基であって、該ヘテロアリール部分が、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

5 分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、 N,N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、
10 または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

15 ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

N,N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アル
20 キル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロラルキル基；

(7)アリール基であって、該アリール基が

25 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、 N, N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、
5 または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

10 ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

N, N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

15 $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(8)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

20 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、 N, N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、
25 または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

ル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、
水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

5 ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

$N, N\text{-ジ}(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

10 $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アル
キル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘ
テロアリール基、

15 からなる群より選択される基であり、そして n は1から12の整数であ
る) ;

(viii) $-(CH_2)_nCONR^{12}R^{13}$ (ここで、 R^{12} および R^{13} はそれぞ
れ独立して、

(1) 水素原子、

(2) 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

20 (3) アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$
1 (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim$
25 C_4 アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アル}$
キル) カルバモイル基、 $N, N\text{-ジ}(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

または -NHCO R^9 （ここで、 R^9 は分岐していてもよい $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基である）で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$\text{-NR}^{20}\text{R}^{21}$ （ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、

5 水素原子または $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基である）、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$\text{N- (C}_1 \sim \text{C}_4 \text{アルキル) カルバモイル基、}$

$\text{N, N-ジ (C}_1 \sim \text{C}_4 \text{アルキル) カルバモイル基、}$

10 -NHCO R^9 （ここで、 R^9 は分岐していてもよい $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基である）、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

15 (4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $\text{C}_1 \sim \text{C}_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基、シアノ基、 $\text{-NR}^{20}\text{R}^{21}$ （ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基である）、ニトロ基、カルバモイル基、 $\text{N- (C}_1 \sim \text{C}_4 \text{アルキル) カルバモイル基、}$
20 $\text{N, N-ジ (C}_1 \sim \text{C}_4 \text{アルキル) カルバモイル基、}$
または -NHCO R^9 （ここで、 R^9 は分岐していてもよい $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基である）で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

25 $\text{-NR}^{20}\text{R}^{21}$ （ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基である）、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

5 -NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

10 からなる群より選択される基であり、そしてnは1から12の整数である) ;

(ix) - (CH₂)_nNR¹²COR¹³ (ここで、R¹²およびR¹³はそれぞれ独立して、

(1)水素原子、

15 (2)分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

(3)アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁~C₅アルコキシ基、

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、シアノ基、-NR²⁰R²¹

20 ⁱ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁~C₄アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、または-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

25 シアノ基、

-NR²⁰R²¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、

水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

5

N, N-ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

-NHCO R^9 (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ア

10

リール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、-NR²⁰R²

15

¹ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、N, N-ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、または-NHCO R^9 (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

20

シアノ基、

-NR²⁰R²¹ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、

水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

25

N- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

—NHCOR⁹（ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基である）、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そしてnは1から12の整数である）；

(x) —(CH₂)_nNR¹²R¹³（ここで、R¹²およびR¹³はそれぞれ独立して、

(1) 水素原子、

(2) 分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、

(3) アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁～C₅アルコキシ基、

分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、シアノ基、—NR²⁰R²¹

（ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁～C₄アルキル基である）、ニトロ基、カルバモイル基、N—(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、N、N—ジ(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、または—NHCOR⁹（ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基である）で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

—NR²⁰R²¹（ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁～C₄アルキル基である）、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N—(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、

N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

-NHCO R⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である)、および

ハロゲン原子

5 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁~C₅アルコキシ基、

10 分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、シアノ基、-NR²⁰R²¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁~C₄アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、または-NHCO R⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

-NR²⁰R²¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁~C₄アルキル基である)、

ニトロ基、

20 カルバモイル基、

N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

-NHCO R⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である)、および

25 ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘ

テロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そして n は 1 から 12 の整数である) ;

(xi) — $(CH_2)_n Y - OR^{12}$ (ここで、 Y は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ の二価の飽和炭化水素基であり、 R^{12} は、

(1) 水素原子、

(2) 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

(3) アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

10 分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$

(ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、 N, N -ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

15 または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

20 ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

N, N -ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アル

25 キル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

5 分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$

¹ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim$

C_4 アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アル

キル)カルバモイル基、 N,N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

10 または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

15 ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

N,N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アル

20 キル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そして n は1から12の整数である) ;

25

(xii) $-(CH_2)_n-OR^{12}$ (ここで、 R^{12} は、

(1) 水素原子、

(2) 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

(3) アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

5 分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$

¹ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim$

C_4 アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アル

キル) カルバモイル基、 N, N -ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

10 または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、
水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

15 ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

N, N -ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

20 $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

25 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、 N,N -ジ $(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、
 5 または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

10 ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

N,N -ジ $(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

15 $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

20 からなる群より選択される基であり、そして n は1から12の整数である) ;

(xiii) $-(CH_2)_n-S-R^{12}$ (ここで、 R^{12} は、

(1)水素原子、

(2)分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

(3)アリール基であって、該アリール基が

25 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、 N, N -ジ $(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、
5 または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

10 ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

N, N -ジ $(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

15 $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

20 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、 N, N -ジ $(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、
25 または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

ル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、
水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) 、

5 ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ カルバモイル基、

N, N -ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

10 $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アル
キル基である) 、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘ
テロアリール基、

15 からなる群より選択される基であり、そして n は1から12の整数であ
る) ;

(xiv) $-(CH_2)_n-SO-R^{12}$ (ここで、 R^{12} は、

(1) 水素原子、

(2) 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

(3) アリール基であって、該アリール基が

20 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$
1 (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim$
 C_4 アルキル基である) 、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アル
25 キル) カルバモイル基、 N, N -ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、
または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキ

ル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、
水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

5

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

$N, N\text{-ジ}(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アル
キル基である)、および

10

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ア
リール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

15

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$
(ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim$
 C_4 アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アル}$
キル) カルバモイル基、 $N, N\text{-ジ}(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、
または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキ
ル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

20

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、
水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

25

ニトロ基、

カルバモイル基、

N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

-NHCO R⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アル

5 キル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘ
テロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そしてnは1から12の整数であ
10 る) ; ならびに

(xv) - (CH₂)_n - SO₂ - R¹² (ここで、R¹²は、

(1)水素原子、

(2)分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

(3)アリール基であって、該アリール基が

15 分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁~C₅アルコキシ基、

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、シアノ基、-NR²⁰R²

¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁~
C₄アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N- (C₁~C₄アル

20 キル) カルバモイル基、N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

または-NHCO R⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキ
ル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

-NR²⁰R²¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、

25 水素原子またはC₁~C₄アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アル

5 キル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

10 分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁~C₅アルコキシ基、

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、シアノ基、-NR²⁰R²

¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁~C₄アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N- (C₁~C₄アル

15 キル) カルバモイル基、N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

または-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

-NR²⁰R²¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、

20 水素原子またはC₁~C₄アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

25 -NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である)、および

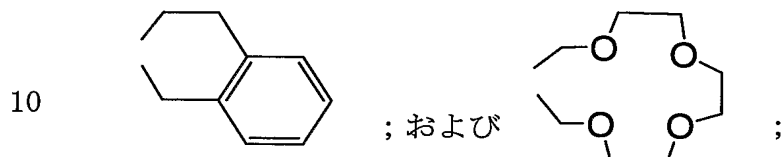
ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そしてnは1から12の整数である) ;

からなる群より選択される基であるか、あるいは、

R^7 および R^8 は一緒になって、 $-(CH_2)_m-$ (ここで、mは2から8の整数である) ;



からなる群より選択される二価の基を表す、方法。

10. 前記式 (I I) で表される化合物の R^1 、 $R^{1'}$ 、 R^2 、 $R^{2'}$ 、 R^3 、 $R^{3'}$ 、 R^4 、 $R^{4'}$ 、 R^5 、 $R^{5'}$ 、 R^6 および $R^{6'}$ が、それぞれ独立して、

(i) 水素原子 ;

(xiv) アリール基であって、ここで、該アリール基が、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

20 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$

(ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、 N,N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、または $-NHCO R^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

5 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

N,N -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

$-NHCO R^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ハロゲン原子および

10 $-S(O)_n-R$ (ここで、 n は0、1または2であり、そして R は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) ;

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、あるいは3, 4位が一緒になって $-O-(CH_2)_m-O-$ (ここで、 m は1または2である)

15 で置換されていてもよい、アリール基 ; ならびに

(xv)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$

20 (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、 N,N -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、または $-NHCO R^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

25 シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素

原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N-($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

5 N, N-ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

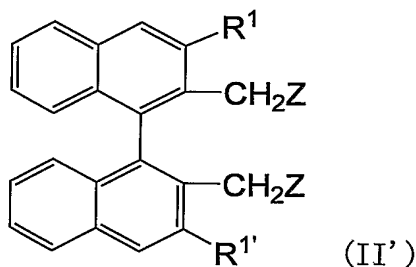
からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘ

10 テロアリール基;

からなる群より選択される基である、請求項9に記載の方法。

11. 前記式 (I I) で表される化合物のR¹、R^{1'}、R²、R^{2'}、R³、R^{3'}、R⁴、R^{4'}、R⁵、R^{5'}、R⁶およびR^{6'}が、それぞれ独立して、水素
15 原子、3, 4, 5-トリフルオロフェニル基、3, 4, 5-トリクロロフェニル基、3, 4-ジフルオロフェニル基、3-ニトロフェニル基、3-シアノフェニル基、ベンゾチオフェニル-2-イル基、3, 5-ジフルオロフェニル基、3-トリフルオロメチルフェニル基、2, 4-ジフルオロフェニル基、3-メチルスルホニルフェニル基、および2, 3-ビス(トリフルオロメチル)フェニル基からなる群より選択される基である、請求項10に記載の方法。

12. 前記式 (I I) で表される化合物が、以下の式 (I I') :



(ここで、 R^1 および $R^{1'}$ は、それぞれ独立して、水素原子、3, 4, 5-トリフルオロフェニル基、3, 4, 5-トリクロロフェニル基、3, 4-ジフルオロフェニル基、3-ニトロフェニル基、3-シアノフェニル基、ベンゾチオフェニル-2-イル基、3, 5-ジフルオロフェニル基、3-トリフルオロメチルフェニル基、2, 4-ジフルオロフェニル基、3-メチルスルホニルフェニル基、および2, 3-ビス(トリフルオロメチル)フェニル基からなる群より選択される基であり、そして R^7 、 R^8 および Z は、それぞれ独立して、請求項9と同様に定義される基である)で表される化合物である、請求項11に記載の方法。

13. 前記式(I I)で表される2級アミンの R^7 および R^8 がそれぞれ独立して、

(ii)分岐または環を形成していてもよい、 $C_1 \sim C_{12}$ のアルキル基；ならびに

(xii) $-(CH_2)_n-OR^{12}$ (ここで、 R^{12} は、

(1)水素原子、

(2)分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

(3)アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$

(ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、 N, N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、または $-NHCO R^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

5

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

$N, N\text{-ジ}(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

$-NHCO R^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

10

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

15

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、 $N, N\text{-ジ}(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、
20 または $-NHCO R^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

25

ニトロ基、

カルバモイル基、

N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

-NHCO R⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である)、および

5 ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そしてnは1から12の整数である) ;

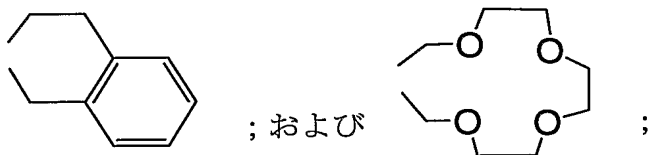
10 からなる群より選択される基である、請求項9に記載の方法。

14. 前記式 (I I) で表される2級アミンのR⁷およびR⁸がそれぞれ独立して、メチル基、エチル基、n-ブチル基、イソブチル基、n-デシル基、およびシクロヘキシル基からなる群より選択される基である、請求項13に記載の方法。

15

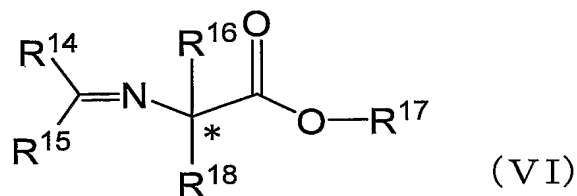
15. 前記式 (I I) で表される2級アミンのR⁷およびR⁸が同一である、請求項14に記載の化合物。

20 16. 前記式 (I I) で表される2級アミンのR⁷およびR⁸が一緒になって、-(CH₂)_m- (ここで、mは2から8の整数である) ;



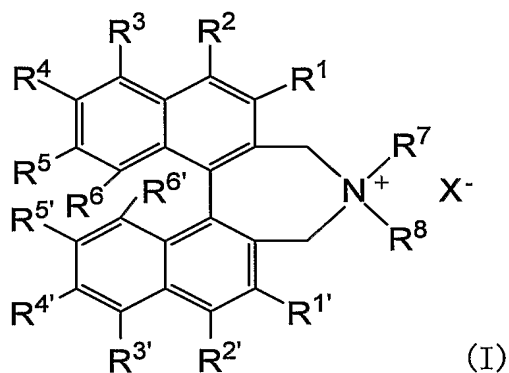
25 からなる群より選択される二価の基を表す、請求項9に記載の方法。

17. 式 (V I) で表される化合物 :

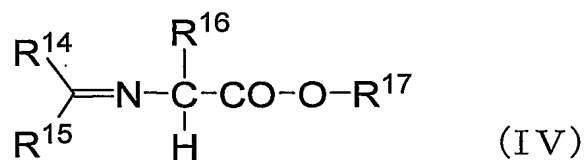


を立体選択的に製造するための方法であって、

軸不斉に関して純粋な式 (I) :



で表される化合物を相間移動触媒として用い、式 (I V) で表される化合物 :



を、媒体中、無機塩基の存在下、式 (V) の化合物 :



でアルキル化する工程、を包含し、

ここで、式 (I) において、

R^1 、 $\text{R}^{1'}$ 、 R^2 、 $\text{R}^{2'}$ 、 R^3 、 $\text{R}^{3'}$ 、 R^4 、 $\text{R}^{4'}$ 、 R^5 、 $\text{R}^{5'}$ 、 R^6 および

$R^{6'}$ は、それぞれ独立して、

(i) 水素原子；

(ii) $-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)；

5 (iii) シアノ基；

(iv) ニトロ基；

(v) カルバモイル基；

(vi) $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ カルバモイル基；

(vii) N, N -ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基；

10 (viii) $-NHCO R^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)；

(ix) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_1 \sim C_6$ のアルキル基；

(x) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$ のアルケニル基；

(xi) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$ のアルキニル基；

15 (xii) アラルキル基であって、ここで、該アラルキル基を構成するアリアル部分が、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

20 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ カルバモイル基、 N, N -ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、または $-NHCO R^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) で置換されていてもよい、アリアル基、

25 シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素

原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

5 N, N-ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

-NHCO R^9 (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アラ
10 ラルキル基;

(xiii)ヘテロアリール部分を有するヘテロアラルキル基であって、ここで、
該ヘテロアリール部分が、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

15 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、-NR²⁰R²¹

(ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、N, N-ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、または-NHCO R^9 (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル

20 基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

-NR²⁰R²¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

25 カルバモイル基、

N- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、
 $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル
 基である)、および
 ハロゲン原子

5 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘ
 テロアルキル基;

(xiv)アリール基であって、ここで、該アリール基が、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

10 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$
 (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$
 C_4 アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N- ($C_1 \sim C_4$ アルキ
 ル) カルバモイル基、N, N-ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、ま
 たは $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル
 15 基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素
 原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

20 カルバモイル基、

N- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル
 基である)、

25 ハロゲン原子、および

$-S(O)_n-R$ (ここで、 n は0、1または2であり、そして R は分

岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよいか、あるいは3, 4位が一緒になって $-O-(CH_2)_m-O-$ (ここで、 m は1または2である) で置換されていてもよい、アリール基 ; ならびに

5 (xv) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$

10 (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、 N, N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

15 $-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

20 N, N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基 ;

25

からなる群より選択される基であり、

R^7 および R^8 はそれぞれ独立して、一価の有機基であるか、あるいは一緒になって二価の有機基を表し、

X^- は、ハロゲン化物アニオンであり、

式 (I V) および式 (V I) において、

5 R^{14} および R^{15} は、それぞれ独立して、

(i) 水素原子；あるいは

(ii) 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基か、分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基か、またはハロゲン原子かで置換されていてもよい、アリール基；

10 であり、ただし R^{14} および R^{15} がともに水素原子である場合を除き、

R^{16} は、

(i) 水素原子；

(ii) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_1 \sim C_{10}$ のアルキル基；

(iii) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$ のアルケニル基；

15 (iv) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$ のアルキニル基；

(v) アラルキル基であって、該アラルキル基を構成するアリール部分が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$

20 (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、 N,N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

25 シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素

原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

5 N, N-ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

-NHCO R^9 (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アラルキル基;

10

(vi) ヘテロアリール部分を有するヘテロアラルキル基であって、該ヘテロアリール部分が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

15

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、-NR²⁰R²¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、N, N-ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、または-NHCO R^9 (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

20

シアノ基、

-NR²⁰R²¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

25

カルバモイル基、

N- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、
 -NHCO R⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル
 基である)、および
 ハロゲン原子

5 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘ
 テロアラルキル基;

(vii)アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁~C₅アルコキシ基、

10 分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、シアノ基、-NR²⁰R²¹
 (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁~C₄
 アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N-(C₁~C₄アルキ
 ル) カルバモイル基、N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、ま
 たは-NHCO R⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル
 15 基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

-NR²⁰R²¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素
 原子またはC₁~C₄アルキル基である)、

ニトロ基、

20 カルバモイル基、

N-(C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

-NHCO R⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル
 基である)、および

25 ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ア

リール基；ならびに

(viii)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

- 5 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$
(ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$
アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)
カルバモイル基、 N,N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、ま
たは $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル
10 基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素
原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

- 15 カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

N,N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル
基である)、および

- 20 ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘ
テロアリール基；

からなる群より選択される基であり、

R^{17} は、分岐または環を形成していてもよい $C_1 \sim C_8$ アルキル基であり、

- 25 式(V)および式(VI)において、

R^{18} は、

- (i) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル基；
- (ii) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_3 \sim C_9$ のアリル基または置換アリル基；
- (iii) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$ のアルケニル基；
- 5 (iv) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$ のアルキニル基；
- (v) アラルキル基であって、該アラルキル基を構成するアリール部分が分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、
- 分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、
- 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$
- 10 (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ カルバモイル基、 N 、 N -ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、
- 15 シアノ基、
- $-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、
- ニトロ基、
- カルバモイル基、
- 20 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ カルバモイル基、
- N 、 N -ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、
- $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および
- ハロゲン原子
- 25 からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、アラルキル基；

(vi) ヘテロアリール部分を有するヘテロアラルキル基であって、該ヘテロアリール部分が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

5 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$

(ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)

カルバモイル基、 N, N -ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、ま

たは $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル

10 基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

15 カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

N, N -ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

20 ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、ヘテロアラルキル基；

(vii) アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

25 分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$

(ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、 N, N -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、または $-NHCO R^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

10 カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

N, N -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

$-NHCO R^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

15 ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基;

(viii) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

20 分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$

(ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、 N, N -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、または $-NHCO R^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

25

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

5 カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

$N, N\text{-ジ}(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

$-NHCO R^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

10 ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基；ならびに

(ix)分岐していてもよい、 $C_3 \sim C_9$ のプロパルギル基または置換プロパルギル基；

15 からなる群より選択される基であり、

式(V)において、

Wは、脱離能を有する官能基であり、

そして式(VI)において

*は、新たに生成する不斉中心を示す、方法。

20

18. 前記式(I)で表される化合物の R^7 および R^8 が、それぞれ独立して、

(i)分岐または環を形成していてもよく、および/またはハロゲン原子で置換されていてもよい、 $C_1 \sim C_{12}$ のアルキル基；

25 (ii)分岐または環を形成していてもよく、および/またはハロゲン原子で置換されていてもよい、 $C_2 \sim C_{12}$ のアルケニル基；

(iii)分岐または環を形成していてもよく、および／またはハロゲン原子で置換されていてもよい、 $C_2 \sim C_{12}$ のアルキニル基；

(iv)アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

5 分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$

(ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、 N,N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

15 ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

N,N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

20 $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基；

(v)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

25 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$
 (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$
 C_4 アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)
 カルバモイル基、 N,N -ジ $(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、ま
 5 たは $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル
 基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素
 原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

10 ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

N,N -ジ $(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル
 15 基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘ
 テロアリール基；

(vi) $-(CH_2)_nOCONR^{10}R^{11}$ (ここで、 R^{10} および R^{11} はそれぞ
 20 れ独立して、

(1)水素原子、

(2)分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

(3)分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$ のアルケニル基；

(4)分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$ のアルキニル基；

25 (5)アラルキル基であって、該アラルキル基を構成するアリール部分

が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、 N,N -ジ $(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

N,N -ジ $(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基；

(6)ヘテロアリール部分を有するヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール部分が、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim$

C₄アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N-(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基、N,N-ジ(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基、または-NHCOR⁹(ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

5 シアノ基、

-NR²⁰R²¹(ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁~C₄アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

10 N-(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基、

N,N-ジ(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基、

-NHCOR⁹(ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である)、および

ハロゲン原子

15 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアラルキル基;

(7)アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁~C₅アルコキシ基、

20 分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、シアノ基、-NR²⁰R²¹
 1 (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁~C₄アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N-(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基、N,N-ジ(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基、または-NHCOR⁹(ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

25

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

5 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

N, N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

$-NHCO R^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

10 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(8)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

15 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、 N, N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、または $-NHCO R^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

20

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

25 カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

-NHCO R⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である)、および

ハロゲン原子

- 5 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、
 からなる群より選択される基であり、そしてnは1から12の整数である) ;

10 (vii) - (CH₂)_n CONR¹² R¹³ (ここで、R¹²およびR¹³はそれぞれ独立して、

(1)水素原子、

(2)分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

(3)アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

15 分岐していてもよいC₁~C₅アルコキシ基、

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、シアノ基、-NR²⁰ R²¹

¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁~C₄アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N- (C₁~C₄アル

20 キル) カルバモイル基、N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、
 または-NHCO R⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

-NR²⁰ R²¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、
 水素原子またはC₁~C₄アルキル基である)、

25 ニトロ基、

カルバモイル基、

N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

-NHCO R⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である)、および

5 ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

10 分岐していてもよいC₁~C₅アルコキシ基、

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、シアノ基、-NR²⁰R²¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁~C₄アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、
15 または-NHCO R⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

-NR²⁰R²¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁~C₄アルキル基である)、

20 ニトロ基、

カルバモイル基、

N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

-NHCO R⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である)、および

25 ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そしてnは1から12の整数である) ;

5 (viii) — (CH₂)_nNR¹²COR¹³ (ここで、R¹²およびR¹³はそれぞれ独立して、

(1) 水素原子、

(2) 分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

(3) アリール基であって、該アリール基が

10 分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁~C₅アルコキシ基、

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、シアノ基、—NR²⁰R²¹

(ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁~C₄アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N—(C₁~C₄アル

15 キル) カルバモイル基、N, N—ジ(C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、または—NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

—NR²⁰R²¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、

20 水素原子またはC₁~C₄アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N—(C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

N, N—ジ(C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

25 —NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

5 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、 N,N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

15 $-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

N,N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

20 $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

25 からなる群より選択される基であり、そして n は1から12の整数である) ;

(ix) $-(CH_2)_nNR^{12}R^{13}$ (ここで、 R^{12} および R^{13} はそれぞれ独立して、

(1) 水素原子、

(2) 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

5 (3) アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$
 1 (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、 N,N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

15 $-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

20 N,N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

25

(4) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$

¹ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim$

5 C_4 アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アル

キル) カルバモイル基、 N, N -ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

または $-NHCO R^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

10 $-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

15 N, N -ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

$-NHCO R^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、ヘ

20 テロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そして n は 1 から 12 の整数である) ;

(x) $-(CH_2)_n Y-OR^{12}$ (ここで、 Y は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ の二価の飽和炭化水素基であり、 R^{12} は、

25 (1) 水素原子、

(2) 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

(3) アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$

5 ¹ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ カルバモイル基、 N, N -ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

10 シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

15 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ カルバモイル基、

N, N -ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

20 からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

25 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$

¹ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim$

C₄アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N-(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基、N,N-ジ(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基、または-NHCOR⁹(ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

5 シアノ基、

-NR²⁰R²¹(ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁~C₄アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

10 N-(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基、

N,N-ジ(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基、

-NHCOR⁹(ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である)、および

ハロゲン原子

15 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そしてnは1から12の整数である) ;

(xi) -(CH₂)_n-OR¹²(ここで、R¹²は、

20 (1)水素原子、

(2)分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

(3)アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁~C₅アルコキシ基、

25 分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、シアノ基、-NR²⁰R²¹

¹(ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁~

C₄アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N-(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基、N,N-ジ(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基、または-NHCOR⁹(ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

5 シアノ基、

 -NR²⁰R²¹(ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁~C₄アルキル基である)、

 ニトロ基、

 カルバモイル基、

10 N-(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基、

 N,N-ジ(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基、

 -NHCOR⁹(ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である)、および

 ハロゲン原子

15 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

 (4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

 分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

 分岐していてもよいC₁~C₅アルコキシ基、

20 分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、シアノ基、-NR²⁰R²¹
 ¹(ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁~C₄アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N-(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基、N,N-ジ(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基、または-NHCOR⁹(ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

25

 シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

5 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

N, N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

$-NHCO R^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

10 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そして n は1から12の整数である) ;

(xii) $-(CH_2)_n-S-R^{12}$ (ここで、 R^{12} は、

15 (1)水素原子、

(2)分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

(3)アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

20 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$

(ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、 N, N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、または $-NHCO R^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

25 シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

5 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

N, N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

$-NHCO R^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

10 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

15 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、 N, N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、または $-NHCO R^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

25 カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

-NHCO R⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である)、および

ハロゲン原子

5 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そしてnは1から12の整数である) ;

(xiii) - (CH₂)_n - SO - R¹² (ここで、R¹²は、

10 (1)水素原子、

(2)分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

(3)アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁~C₅アルコキシ基、

15 分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、シアノ基、-NR²⁰R²¹

(ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁~C₄アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

20 または-NHCO R⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

-NR²⁰R²¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁~C₄アルキル基である)、

ニトロ基、

25 カルバモイル基、

N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

—NHCO R⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である)、および

ハロゲン原子

5 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁~C₅アルコキシ基、

10 分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、シアノ基、—NR²⁰R²¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁~C₄アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N—(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基、N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、または—NHCO R⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

—NR²⁰R²¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁~C₄アルキル基である)、

ニトロ基、

20 カルバモイル基、

N—(C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

—NHCO R⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である)、および

25 ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘ

テロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そして n は 1 から 12 の整数である) ; ならびに

(xiv) $-(CH_2)_n-SO_2-R^{12}$ (ここで、 R^{12} は、

5

(1) 水素原子、

(2) 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

(3) アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

10

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$

(ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、 N 、 N -ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

15

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、

水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

20

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

N 、 N -ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

25

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、ア

リール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

5 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、 N,N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

15 カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

N,N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

20 ハロゲン原子

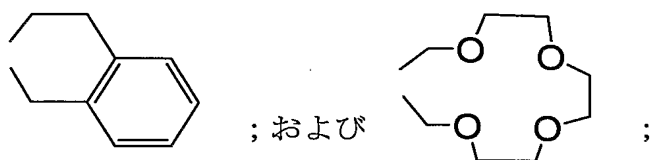
からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そして n は1から12の整数である) ;

25 からなる群より選択される基であるか、あるいは、

一緒になって、 $-(CH_2)_m-$ (ここで、 m は2から8の整数である) ;

295



からなる群より選択される二価の基である、請求項 17 に記載の方法。

5

19. 前記式 (I) で表される化合物の R^1 、 $R^{1'}$ 、 R^2 、 $R^{2'}$ 、 R^3 、 $R^{3'}$ 、 R^4 、 $R^{4'}$ 、 R^5 、 $R^{5'}$ 、 R^6 および $R^{6'}$ が、それぞれ独立して、

(i) 水素原子；

(xiv) アリール基であって、ここで、該アリール基が、

10

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$

(ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)

15

カルバモイル基、 N, N -ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

20

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

N, N -ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

25

$-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ハロゲン原子および

$-S(O)_n-R$ (ここで、 n は0、1または2であり、そして R は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) ;

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよいが、

5 あるいは3, 4位が一緒になって $-O-(CH_2)_m-O-$ (ここで、 m は1または2である)

で置換されていてもよい、アリール基 ; ならびに

(xv) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

10 分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$

(ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)

カルバモイル基、 N,N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、ま

15 たは $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

20 ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

N,N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

25 ハロゲン原子

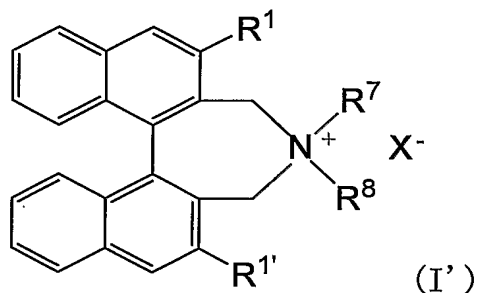
からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基；

からなる群より選択される基である、請求項18に記載の方法。

- 5 20. 前記式(I)で表される化合物の R^1 、 $R^{1'}$ 、 R^2 、 $R^{2'}$ 、 R^3 、 $R^{3'}$ 、 R^4 、 $R^{4'}$ 、 R^5 、 $R^{5'}$ 、 R^6 および $R^{6'}$ が、それぞれ独立して、水素原子、
3, 4, 5-トリフルオロフェニル基、3, 4, 5-トリクロロフェニル基、
3, 4-ジフルオロフェニル基、3-ニトロフェニル基、3-シアノフェニル基、ベンゾチオフェニル-2-イル基、3, 5-ジフルオロフェニル基、
10 3-トリフルオロメチルフェニル基、2, 4-ジフルオロフェニル基、3-メチルスルホニルフェニル基、および2, 3-ビス(トリフルオロメチル)フェニル基からなる群より選択される基である、請求項19に記載の方法。

21. 前記式(I)で表される化合物が、以下の式(I')：

15



- 20 (ここで、 R^1 および $R^{1'}$ は、それぞれ独立して、水素原子、3, 4, 5-トリフルオロフェニル基、3, 4, 5-トリクロロフェニル基、3, 4-ジフルオロフェニル基、3-ニトロフェニル基、3-シアノフェニル基、ベンゾチオフェニル-2-イル基、3, 5-ジフルオロフェニル基、3-トリフルオロメチルフェニル基、2, 4-ジフルオロフェニル基、3-メチルスルホニルフェニル基、および2, 3-ビス(トリフルオロメチル)フェニル基
25 からなる群より選択される基であり、そして R^7 、 R^8 および X^- は、それぞ

れ独立して、請求項 1 と同様に定義される基である) で表される化合物である、請求項 20 に記載の方法。

22. 前記式 (I) で表される化合物の R^7 および R^8 がそれぞれ独立して、

5 (ii) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_1 \sim C_{12}$ のアルキル基 ; ならびに

(xii) $-(CH_2)_n-OR^{12}$ (ここで、 R^{12} は、

(1) 水素原子、

(2) 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

10 (3) アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$

15 1 (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アル

キル) カルバモイル基、 N, N -ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

20 $-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

25 N, N -ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アル

キル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

5 (4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$

1 (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim$

10 C_4 アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アル

キル)カルバモイル基、 N 、 N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

または $-NHCO R^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

15 $-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

20 N 、 N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

$-NHCO R^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘ

25 テロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そして n は1から12の整数であ

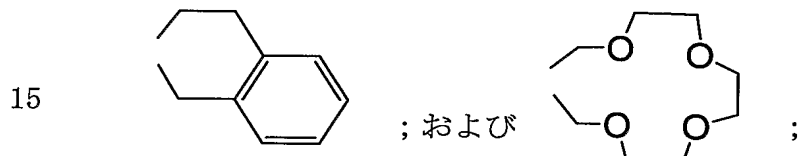
る) ;

からなる群より選択される基である、請求項 17 に記載の方法。

23. 前記式 (I) で表される化合物の R^7 および R^8 がそれぞれ独立して、
5 メチル基、エチル基、 n -ブチル基、イソブチル基、 n -デシル基、および
シクロヘキシル基からなる群より選択される基である、請求項 22 に記載の
方法。

24. 前記式 (I) で表される化合物の R^7 および R^8 が同一である、請求項
10 23 に記載の方法。

25. 前記式 (I) で表される化合物の R^7 および R^8 が一緒になって、
- $(CH_2)_m$ - (ここで、 m は 2 から 8 の整数である) ;



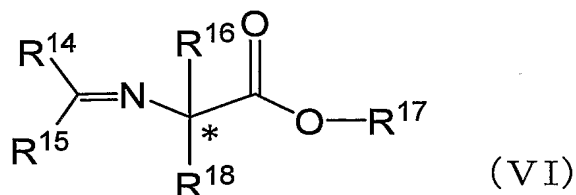
からなる群より選択される二価の基を表す、請求項 17 に記載の方法。

26. 前記式 (IV) で表される化合物 1 モルに対し、前記式 (I) で表さ
20 れる化合物が、0.001 モル% から 0.1 モル% の割合で使用される、請
求項 17 に記載の方法。

27. 前記式 (IV) で表される化合物 1 モルに対し、前記式 (I) で表さ
れる化合物が、0.005 モル% から 0.05 モル% の割合で使用される、
25 請求項 17 に記載の方法。

28. 光学活性な α -アミノ酸を製造するための方法であって、

請求項17から26のいずれかに記載の方法により得られた式(VI)で表される化合物：

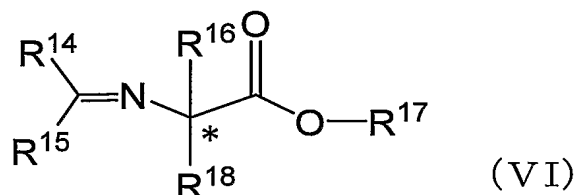


(ここで、 R^{14} 、 R^{15} 、 R^{16} 、 R^{17} および R^{18} は上記に定義した基と同様である) のイミノ基 ($R^{14}R^{15}C=N-$) およびエステル基 ($-CO_2R^{17}$) を酸性条件下で加水分解する工程；を包含する、方法。

10

29. 光学活性な α -アミノ酸を製造するための方法であって、

請求項17から26のいずれかに記載の方法により得られた式(VI)で表される化合物：



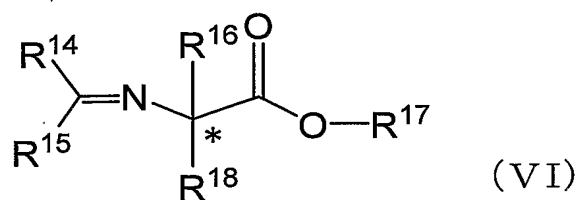
(ここで、 R^{14} 、 R^{15} 、 R^{16} 、 R^{17} および R^{18} は上記に定義した基と同様である) のイミノ基 ($R^{14}R^{15}C=N-$) を酸性条件下で加水分解する工程；および該酸性加水分解産物のエステル基 ($-CO_2R^{17}$) を酸性もしくは塩基性条件下で加水分解する工程；を包含する、方法。

20

30. 光学活性な α -アミノ酸を製造するための方法であって、

請求項17から26のいずれかに記載の方法により得られた式(VI)で表される化合物：

25



5

(ここで、 R^{14} 、 R^{15} 、 R^{16} 、 R^{17} および R^{18} は上記に定義した基と同様である)のエステル基 ($-CO_2R^{17}$) を塩基性条件下で加水分解する工程；および該塩基性加水分解産物のイミノ基 ($R^{14}R^{15}C=N-$) を酸性条件下で加水分解する工程；を包含する、方法。

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2005/001623

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

Int.Cl.⁷ C07D223/14, 498/10, 487/10, 471/10, 405/14, 409/14,
C07C249/02, 251/24, 229/34, 227/10

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

Int.Cl.⁷ C07D223/14, 498/10, 487/10, 471/10, 405/14, 409/14,
C07C249/02, 251/24, 229/34, 227/10

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)

CAPLUS (STN), CAOLD (STN), REGISTRY (STN)

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	OOI, T., Design of N-Spiro C ₂ -Symmetric Chiral Quaternary Ammonium Bromides as Novel Chiral Phase-Transfer Catalysts : Synthesis and Application to Practical Asymmetric Synthesis of α-Amino Acids, Journal of the American Chemical Society, 2003 Nen, Vol.125, No.17, pages 5139 to 5151	1-4, 9-12, 17-21, 26-30
Y		5-8, 13-16, 22-25
X	OOI, T., "Molecular Design of a C ₂ -Symmetric Chiral Phase-Transfer Catalyst for Practical Asymmetric Synthesis of α-Amino Acids.", J. Am.Chem.Soc., 1999 Nen, Vol.121, No.27, pages 6519 to 6520	1-4, 9-12, 17-21, 26-30
Y		5-8, 13-16, 22-25



Further documents are listed in the continuation of Box C.



See patent family annex.

* Special categories of cited documents:

"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

"E" earlier application or patent but published on or after the international filing date

"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art

"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search
08 March, 2005 (08.03.05)

Date of mailing of the international search report
22 March, 2005 (22.03.05)

Name and mailing address of the ISA/
Japanese Patent Office

Authorized officer

Facsimile No.

Telephone No.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2005/001623

C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X Y	JP 2001-48866 A (Nagase & Co., Ltd.), 20 February, 2001 (20.02.01), & WO 01/81349 A1 & EP 1277755 A1 & US 6340753 B1	1-4, 9-12, 17-21, 26-30 5-8, 13-16, 22-25
X Y	ABBOT, A.P., "Electrochemical recognition of charged species using quaternary ammonium binaphthyl salts", Analyst (Cambridge, United Kingdom), 2001 Nen, Vol.126, No.11, pages 1892 to 1896	1-4 5-30
X Y	STARA, I.G., "Nucleophilic cleavage of 4,5-dihydro-3H-dinaphth[2,1-c:1',2'-e] azepinium quaternary salts. A convenient approach to new axially dissymmetric and axially asymmetric ligands", Journal of Organic Chemistry, 1992 Nen, Vol.57, No.25, pages 6966 to 6969	1-16 17-30
X Y	STARA, I.G., "Stereochemical Dichotomy in the Stevens Rearrangement of Axially Twisted Dihydroazepinium and Dihydrothiepinium Salts. A Novel Enantioselective Synthesis of Pentahelicene", Journal of the American Chemical Society, 1994 Nen, Vol.116, No.12, pages 5084 to 5088	1-7, 9-15 8, 16-30
X Y	STARA, I.G., "Nucleophilic Attack on 4,5- Dihydro-4-alkyl-3H-dinaphtho[2,1-c:1',2'-e] thiepinium Salts. A Convenient Approach to New 2,2'-Bidentate 1,1'-Binaphthalene Ligands with Sulfur Donor Atoms", Journal of Organic Chemistry, 1994 Nen, Vol.59, No.6, pp.1326-32	1-7, 9-15 8, 16-30
X Y	STARA, I.G., "Optically pure(S) - and (R)- 4,5-dihydro-3H-4-methyldinaphth[2,1-c:1',2'-e] azepines. Application to the synthesis of new bidentate ligands with axial asymmetry", Tetrahedron: Asymmetry, 1992 Nen, Vol.3, No.11, pp.1365-8	1-7, 9-15 8, 16-30
X Y	COTTINEAU, F., "Reductive cleavage of axially disymmetric tertiary amines and quaternary ammonium salts by lithium aluminum hydride. Synthesis of new 1,1'-binaphthyl substituted amines", Tetrahedron Letters, 1985 Nen, Vol.26, No.4, pages 421 to 424	1-7, 9-15 8, 16-30
X Y	DI BARI, L., "Conformational Study of 2,2'- Homosubstituted 1,1'-Binaphthyls by Means of UV and CD Spectroscopy", Journal of the American Chemical Society, 1999 Nen, Vol.121, No.35, pages 7998 to 8004	1-5, 8-13, 16 6, 7, 14, 15, 17-30

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2005/001623

C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X Y	SHI, M., "Synthesis of axially dissymmetric chiral ammonium salts by quaternization of secondary amines with (R)-(+)-2,2'-bis(bromomethyl)-6,6'-dinitrobiphenyl and (R)-(+)-2,2'-bis(bromomethyl)-1,1'-binaphthyl and an examination of their abilities as chiral phase-transfer catalysts", Journal of Chemical Research, Synopses, 1995 Nen, No.2, pp.46-7	1-5, 8-13, 16 6, 7, 14, 15, 17-30
X Y	MASON, S.F., "Optical activity in the biaryl series", Tetrahedron, 1974 Nen, Vol.30, No.12, pp.1671-82	1-5, 8-13, 16 6, 7, 14, 15, 17-30
P, X P, Y	KANO, T., "Design of new polyamine-based chiral phase-transfer catalysts for the enantioselective synthesis of phenylalanine", Tetrahedron: Asymmetry, 2004 Nen, Vol.15, No.8, pages 1243 to 1245	1-7, 9-15, 17-24 8, 16, 25-30

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2005/001623

The subject matters of claims 1-30 are compounds represented by the formula (I), a method of reaction using the compounds as a catalyst, etc. However, compounds having the basic skeleton in the formula (I) are known as apparent from the fact that they are disclosed in the document (JP 2001-48866 A (Nagase & Co., Ltd.) 20 February, 2001 (20.02.01), etc. Consequently, the compounds claimed are not considered to have a novel basic skeleton common among their chemical structures. One invention cannot hence be grasped from the claims, in which such compounds are described.

On the other hand, a search was made through prior-art documents for the contents of the description of this application. However, in part of the search, many compounds within the scope of the compounds claimed were found.

Furthermore, the compounds which are supported by the description in the meaning of Article 6 of the PCT and disclosed in the description in the meaning of Article 5 of the PCT are limited to an extremely small part of the compounds represented by the formula (I) in claims 1 to 30.

Therefore, an internal search was made for the compounds specified in the description within the range of a reasonable burden.

A. 発明の属する分野の分類 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl.⁷ C07D223/14, 498/10, 487/10, 471/10, 405/14, 409/14, C07C249/02, 251/24, 229/34, 227/10

B. 調査を行った分野

調査を行った最小限資料 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl.⁷ C07D223/14, 498/10, 487/10, 471/10, 405/14, 409/14, C07C249/02, 251/24, 229/34, 227/10

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

国際調査で使用了電子データベース (データベースの名称、調査に使用した用語)

CAPLUS (STN), CAOLD (STN), REGISTRY (STN)

C. 関連すると認められる文献

引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
X	001, T., Design of N-Spiro C ₂ -Symmetric Chiral Quaternary Ammonium Bromides as Novel Chiral Phase-Transfer Catalysts : Synthesis and Application to Practical Asymmetric Synthesis of α -Amino Acids, Journal of the American Chemical Society, 2003年, Vol.125, No.17, pp.5139-5151	1-4, 9-12, 17-21, 26-30
Y		5-8, 13-16, 22-25
X	001, T., "Molecular Design of a C ₂ -Symmetric Chiral Phase-Transfer Catalyst for Practical Asymmetric Synthesis of α -Amino Acids."	1-4, 9-12, 17-21, 26-30
Y	J. Am. Chem. Soc., 1999年, VOL.121, NO.27, pp.6519-6520	5-8, 13-16, 22-25

☒ C欄の続きにも文献が列挙されている。☐ パテントファミリーに関する別紙を参照。

* 引用文献のカテゴリー

「A」 特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの

「E」 国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表されたもの

「L」 優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献 (理由を付す)

「O」 口頭による開示、使用、展示等に言及する文献

「P」 国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願

の日の後に公表された文献

「T」 国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの

「X」 特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの

「Y」 特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの

「&」 同一パテントファミリー文献

国際調査を完了した日

08.03.2005

国際調査報告の発送日

22.03.2005

国際調査機関の名称及びあて先

日本国特許庁 (ISA/J P)

郵便番号100-8915

東京都千代田区霞が関三丁目4番3号

特許庁審査官 (権限のある職員)

安藤 倫世

4 P

9837

電話番号 03-3581-1101 内線 3490

C (続き) . 関連すると認められる文献		
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
X Y	JP 2001-48866 A (長瀬産業株式会社) 2001.02.20 & WO 01/81349 A1 & E P 1277755 A1 & US 6340753 B1	1-4, 9-12, 17-2 1, 26-30 5-8, 13-16, 22- 25
X Y	ABBOT, A. P., "Electrochemical recognition of charged species using quaternary ammonium binaphthyl salts" Analyst (Cambridge, United Kingdom), 2001年, Vol.126, No.11, pp.1892-1896	1-4 5-30
X Y	STARA, I. G., "Nucleophilic cleavage of 4,5-dihydro-3H-dinaphth[2,1-c:1',2'-e]azepinium quaternary salts. A convenient approach to new axially dissymmetric and axially asymmetric ligands" Journal of Organic Chemistry, 1992年, Vol.57, No.25, pp.6966-6969	1-16 17-30
X Y	STARA, I. G., "Stereochemical Dichotomy in the Stevens Rearrangement of Axially Twisted Dihydroazepinium and Dihydrothiepinium Salts. A Novel Enantioselective Synthesis of Pentahelicene" Journal of the American Chemical Society, 1994年, Vol.116, No.12, pp.5084-5088	1-7, 9-15 8, 16-30
X Y	STARA, I. G., "Nucleophilic Attack on 4,5-Dihydro-4-alkyl-3H-dinaphtho[2,1-c:1',2'-e]thiepinium Salts. A Convenient Approach to New 2,2'-Bidentate 1,1'-Binaphthalene Ligands with Sulfur Donor Atoms" Journal of Organic Chemistry, 1994年, Vol.59, No.6, pp.1326-32	1-7, 9-15 8, 16-30
X Y	STARA, I. G., "Optically pure (S)- and (R)-4,5-dihydro-3H-4-methyldinaphth[2,1-c:1',2'-e]azepines. Application to the synthesis of new bidentate ligands with axial asymmetry" Tetrahedron: Asymmetry, 1992年, Vol.3, No.11, pp.1365-8	1-7, 9-15 8, 16-30
X Y	COTTINEAU, F., "Reductive cleavage of axially dissymmetric tertiary amines and quaternary ammonium salts by lithium aluminum hydride. Synthesis of new 1,1'-binaphthyl substituted amines" Tetrahedron Letters, 1985年, Vol.26, No.4, pp.421-424	1-7, 9-15 8, 16-30

C (続き) . 関連すると認められる文献		
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
X Y	DI BARI, L., "Conformational Study of 2,2'-Homosubstituted 1,1'-Binaphthyls by Means of UV and CD Spectroscopy" Journal of the American Chemical Society, 1999年, Vol.121, No.35, pp.7998-8004	1-5, 8-13, 16 6, 7, 14, 15, 17-30
X Y	SHI, M., "Synthesis of axially dissymmetric chiral ammonium salts by quaternization of secondary amines with (R)-(+)-2,2'-bis(bromomethyl)-6,6'-dinitrobiphenyl and (R)-(+)-2,2'-bis(bromomethyl)-1,1'-binaphthyl and an examination of their abilities as chiral phase-transfer catalysts" Journal of Chemical Research, Synopses, 1995年, No.2, pp.46-7	1-5, 8-13, 16 6, 7, 14, 15, 17-30
X Y	MASON, S. F., "Optical activity in the biaryl series" Tetrahedron, 1974年, Vol.30, No.12, pp.1671-82	1-5, 8-13, 16 6, 7, 14, 15, 17-30
PX PY	KANO, T., "Design of new polyamine-based chiral phase-transfer catalysts for the enantioselective synthesis of phenylalanine" Tetrahedron: Asymmetry, 2004年, Vol.15, No.8, pp.1243-1245	1-7, 9-15, 17-24 8, 16, 25-30

請求の範囲1-30に係る発明は、式(I)で表される化合物又はそれを触媒とする反応方法等の発明であるが、式(I)における基本骨格を有する化合物が、文献(JP 2001-48866 A (長瀬産業株式会社) 2001.02.20)等により公知であるから、本願発明化合物は、その化学構造において、新規な基本骨格が共通しているものとはいえない。してみれば、このような化合物を記載する上記請求の範囲各項からは、一の発明を明確に把握することができない。

一方、本願明細書の記載内容に照らし、先行技術文献調査を試みたが、その調査の一部において、既に、本願発明化合物に該当する化合物が多数発見されている。

また、特許協力条約第6条の意味において明細書に裏付けられ、また、特許協力条約第5条の意味において明細書に開示されているものは、請求の範囲1-30の発明における式(I)で表される化合物の中の、ごく僅かな部分に過ぎない。

したがって、この国際調査では、明細書に具体的に記載された化合物に基づき、合理的な負担の範囲内で調査を行った。